

This Page Is Inserted by IFW Operations
and is not a part of the Official Record

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

**As rescanning documents *will not* correct images,
please do not report the images to the
Image Problem Mailbox.**

No. 2

PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 01-265014
 (43)Date of publication of application : 23.10.1989

(51)Int.CI. A61K 7/42
 C07D311/04
 C11D 3/48

(21)Application number : 63-267016 (71)Applicant : PROCTER & GAMBLE CO:THE
 (22)Date of filing : 22.10.1988 (72)Inventor : BISSETT DONALD L
 BUSH RODNEY D

(30)Priority

Priority number : 87 112574 Priority date : 22.10.1987 Priority country : US

(54) OPTICALLY PROTECTING COMPOSITION CONTAINING TOCOPHEROL SORBATE

(57)Abstract:

PURPOSE: To obtain an optically protecting topical composition containing tocopherol sorbate and useful for protecting the skin from a harmful effect caused by irradiation of ultraviolet rays such as sunburn, and premature aging induced by the sunshine without preventing a sunburn response.

CONSTITUTION: This optically protecting topical composition containing tocopherol sorbate includes safe and optically protective amount, preferably 1-20wt.%, more preferably 2-5wt.% of the tocopherol sorbate, and safe and optically effective amount of a topical carrier, and preferably has a lotion, cream, gel, aerosol spray, cosmetic foundation or lip color form. The compound penetrates into the skin and prevents a damaging reaction in the skin by the radical captive and photochemical reaction scavenging activities in the skin, so the protecting effect is not affected by scraping, wearing out or washing out of the active ingredient. The compound is preferably applied to the skin in 0.01-1.0mg/cm², preferably 0.05-0.5mg/cm² until 4hr before exposure of the skin to the ultraviolet rays.

LEGAL STATUS

[Date of request for examination]

[Date of sending the examiner's decision of rejection]

[Kind of final disposal of application other than the examiner's decision of rejection or application converted registration]

[Date of final disposal for application]

[Patent number]

[Date of registration]

[Number of appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of requesting appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of extinction of right]

Copyright (C); 1998,2003 Japan Patent Office

(書誌+要約+請求の範囲)

- (19)【発行国】日本国特許庁(JP)
 (12)【公報種別】特許公報(B2)
 (11)【特許番号】第2812690号
 (24)【登録日】平成10年(1998)8月7日
 (45)【発行日】平成10年(1998)10月22日
 (54)【発明の名称】ソルビン酸トコフェロールを含有する光保護組成物
 (51)【国際特許分類第6版】

A61K 7/48
 7/00
 7/42
 31/355 ADL
 // C07D311/72 102

【FI】

A61K 7/48
 7/00 D
 7/42
 31/355 ADL
 C07D311/72 102

【請求項の数】9

【全頁数】25

- (21)【出願番号】特願昭63-267016
 (22)【出願日】昭和63年(1988)10月22日
 (65)【公開番号】特開平1-265014
 (43)【公開日】平成1年(1989)10月23日
 【審査請求日】平成7年(1995)10月6日
 (31)【優先権主張番号】112574
 (32)【優先日】1987年10月22日
 (33)【優先権主張国】米国(US)

(73)【特許権者】

【識別番号】999999999

【氏名又は名称】ザ、プロクター、エンド、ギャンブル、カンパニー

【住所又は居所】アメリカ合衆国オハイオ州、シンシナチ、ワン、プロクター、エンドギャンブル、プラザ(番地なし)

(72)【発明者】

【氏名】ドナルド、リン、ビセット

【住所又は居所】アメリカ合衆国オハイオ州、ハミルトン、ダスト、コマンダー、ドライブ、3925

(72)【発明者】

【氏名】ロドニー、ディーン、ブッシュ

【住所又は居所】アメリカ合衆国オハイオ州、シンシナチ、クレイバーン、サークル、1778

(74)【代理人】

【弁理士】

【氏名又は名称】佐藤一雄(外2名)

【審査官】井上典之

(56)【参考文献】

【文献】特開平1-265015(JP, A)

(58)【調査した分野】(Int. Cl. 6, DB名)

A61K 7/00 - 7/50

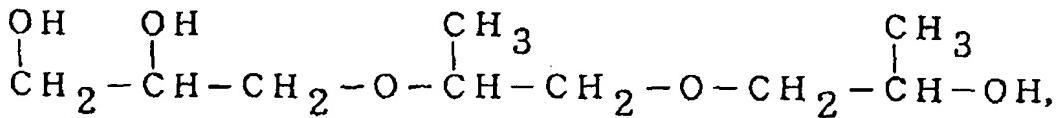
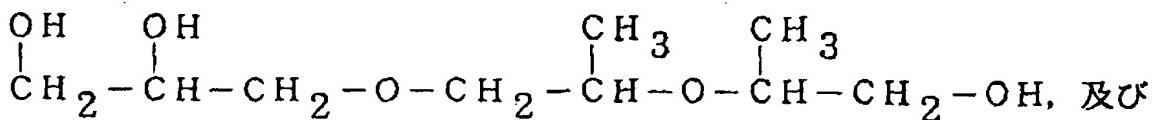
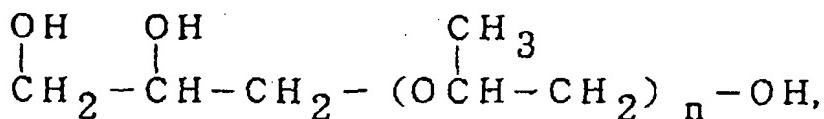
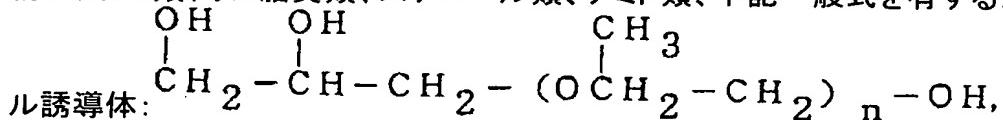
A61K 31/355

CA(STN)

(57)【特許請求の範囲】

【請求項1】それが1%～20%のソルビン酸トコフェロール、および50～99重量%の局所担体を含んでなることを特徴とする局所適用に有効な組成物。

【請求項2】担体が炭化水素油類及びワックス類、シリコーン油類、トリグリセリドエステル類、アセトグリセリドエステル類、エキシル化グリセリド類、脂肪酸類のアルキルエステル類、脂肪酸類のアルケニルエステル類、脂肪酸類、脂肪アルコール類、脂肪アルコールエーテル類、エキシル化脂肪アルコール類の脂肪酸エステル類、エーテルーエステル類、ラノリン及びその誘導体、多価アルコール類、ポリエーテル誘導体、多価アルコールエステル類、ワックスエステル類、蜜蠟誘導体、植物ワックス類、リン脂質類、ステロール類、アミド類、下記一般式を有するプロポキシル化グリセロ-



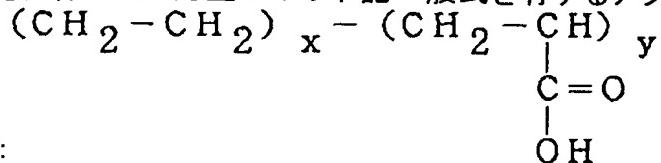
(式中、n = 1又は2)

及びそれらの混合物から選ばれる皮膚軟化剤よりなる請求項1に記載の組成物。

【請求項3】担体が下記成分を含んでなるシリコーン中水中油流体エマルジョン組成物よりなる請求項1に記載の組成物:(a) エマルジョン組成物の15乃至90重量%の本質的に少なくとも一種の液体有機ポリシロキサンよりなるシリコーン流体連続相;

(b) エマルジョン組成物の30乃至80重量%の水相中に分散した化粧品上許容可能な油性液体非一粒状相の水中油エマルジョンよりなる水性不連続相; 及び(c) エマルジョン組成物の0.5乃至5重量%の(b)を(a)中に分散するのに有効分散量のジメチコンコポリオール。

【請求項4】担体が0.25乃至3%の下記一般式を有するアクリル酸共重合体よりなる請求項1に記載



の組成物:

(式中、x:yの比は1:9乃至1:24であり、共重合体の分子量は3500乃至4500である)

【請求項5】担体が化粧品上許容可能な5%乃至80%の界面活性剤を含んでなる棒石けん、液体石けん、ペースト或いはムースの形態である皮膚の清浄化に有用である請求項1に記載の組成物。

【請求項6】更に1～5重量%の浸透向上剤を含んでなる請求項1乃至4のいずれかに記載の組成物。

【請求項7】更に1%乃至10%の2-エチルヘキシルp-メキシシンナメート、ブチルメトキシジベンゾイルメタン、2-ヒドロキシ-4-メキシベンゾフェノン、オクチルジメチルp-アミノ安息香酸、2,4-ジヒドロキシベンゾフェノンの4-N,N-(2-エチルヘキシル)メチルアミノ安息香酸エステル、4-ヒドロキシジベンゾイルメタンのN,N-ジ(2-エチルヘキシル)-4-アミノ安息香酸エステル、4-ヒドロキシジベンゾイルメタンの4-N,N-(2-エチルヘキシル)メチルアミノ安息香酸エステル、2-ヒドロキシ-4-(2-ヒドロキシエトキシ)ベンゾフェノンの4-N,N-(2-エチルヘキシル)メチルアミノ安息香酸エステル、4-(2-ヒドロキシエトキシ)ジベンゾイルメタンの4-N,N-(2-エチ

ルヘキシル)メチルアミノ安息香酸エステル、2-ヒドロキシ-4-(2-ヒドロキシエトキシ)ベンゾフェノンのN,N-ジ-(2-エチルヘキシル)-4-アミノ安息香酸エステル、4-(2-ヒドロキシエトキシ)ジベンゾイルメタンのN,N-ジ-(2-エチルヘキシル)-4-アミノ安息香酸エステル及びそれらの混合物から選ばれる日焼け止め剤を含んでなる請求項1乃至4のいずれかに記載の組成物。

【請求項8】ローション、クリーム、ゲル、エアロゾルスプレー、化粧品ファンデーション或いは口紅の形態であることを更に特徴とする請求項1記載の組成物。

【請求項9】2~5重量%のソルビン酸トコフェロールを含むことを特徴とする請求項1記載の組成物。

詳細な説明

【発明の詳細な説明】

技術分野 本発明は紫外線照射の有害な効果、例えば、皮膚の日焼け及び日光一誘発早期老化などから皮膚を保護するのに有用な局所用組成物に関する。

発明の背景 日光浴は世界中で人気のある活動である。日焼けには健康、美、地位及び富が伴う。多くのレジャータイム活動、例えば水泳、テニス、ゴルフ、釣りが日光の中で行われる。更に、多くの人々は彼等の職業のために長時間強制的に日光の中に居なければならない。

しかしながら、日光の皮膚に及ぼす損傷効果は文献に良く記されている。殆んどの人が考えているのとは反対に、過剰のUV曝露の悪影響を被るのに日光浴をする必要はない。事実、単に日光内の日常的な毎日の活動によって多くの損傷がなされ得る。科学者のあるものは、太陽が平均人の皮膚に人生の間及ぼす70%を越える損傷は単に戸外に居るか或いは窓の側に座っている結果であると推定している。

日光への長時間曝露の主たる短期間の危害は紅斑(即ち、日焼け)である。「UVB」波長範囲と称される290~320ナノメータの波長紫外線照射範囲が紅斑の主たる原因となる傾向を示す。「UVA」波長範囲と称される320~400ナノメータの波長紫外線照射範囲も又紅斑を生成する。

紅斑の短期間危害に加えて、UV照射曝露に伴う長期間の危害もある。これらの長期間危害の一つは皮膚表面における悪性変化である。数多くの疫学的研究は日光曝露と人皮膚癌の間の強い関係を示している。紫外線照射のもう一つの長期間危害は皮膚の早期老化である。この状態は皮膚のしわ形成及び黄色化、ならびにあか切れ、毛細管拡張症(くも血管)、太陽角化症(成長)、斑状出血(皮下出血病巣)及び弹性の喪失(垂れ下り)などのその他の物理的変化により特徴付けられる。UVA及びUVB波長照射への曝露に伴う悪影響により十分にデシモン(DeSimone)、「日焼け止め及び日焼け製品(Sunscreen and Suntan Products)」、Handbook of Nonprescription Drugs、第7版、26章、499~511頁、(American Pharmaceutical Association, Washington, D.C., 1982); グローブ及びフォーブス(Grove and Forbes)、「日焼け止め剤のUA-A照射に対する光保護作用の評価方法(A Method for Evaluating the Photoprotection Action of Sunscreen Agents Against UV-A Radiation)」、International Journal of Cosmetic Science、4、15~24頁(1982); 及び米国特許4,387,089号明細書に書かれており、これらの全ての開示内容は茲に準用する。故に、紫外線照射の即時の影響は化粧品的に且つ社会的に満たされているが、長期間の危害は累積的であり、潜在的に深刻である。

これらの影響が一般大衆により深刻に受止められている事実は太陽保護製品市場を考慮することにより示唆される。この市場は近年相当成長し、数多くの新しい製品が毎年導入されている。従来、季節的営業とみなされていたものは最早ない。太陽保護化合物は現在では各種個人手当製品、特に毎日着用される化粧品タイプの製品に含まれている。

明らかに、過度のUV曝露を避ける最も有効な方法は単に太陽の中の外に出ることを慎むことである。これは非実用的な解決であるのみならず、戸外で働く人にとっては不可能なことである。更に、日光曝露のある種の効果は有益なものである。ビタミンDはUV照射に曝露された皮膚において合成される。このビタミンの体内の欠乏はくる病、即ち骨軟化症を引起し得る。又、最近の研究は人の幸福感を高め得る方法で物理的過程を変更し得ることを示唆している。

日焼け止め剤は自然に室内に存在する。これらにはメラニン、カロテノイド類、ウロカン酸、タンパク質類、及び脂質類などが含まれる。これらの天然の日焼け止め剤は、しかしながら、完全な保護は与えず、極めて明るい皮膚を有する人に対してはそれらは殆んど保護を与えない。

長年に亘って、UV曝露の影響を緩和するための多くの手段が考えられてきている。中東諸国においては人々は彼等の皮膚を長い衣装、カフィエ、及びベールで遮っている。これは、しかしながら、殆んどの人々にとって受け入れられない解放方法である。

皮膚をUV照射から保護するために、光遮断剤が市販されている。これらの試剤は、紫外線照射を散乱或いは反射させるものである。具体例としては、二酸化チタン及び酸化亜鉛が挙げられる。しかしながら、これらの試剤を含む組成物は不透明であり通常色が魅力的でなく鼻或いは耳の頂部以外に使用するのに受け入れられないものとみなされている。更に、これらの試剤は極めて擦り落し、或いは摩耗しやすく、その結果殆んど或いは全く保護が得られない。

もう一つの利用可能な試剤は太陽に曝露なしに「日焼け(tan)」を与えるものである。その様な試剤は通常皮膚染料よりなり、有害なUV照射に対して全く保護を与えるものではない。これらの試剤は日焼けの外観は望まれる如何なる場所においても皮膚に適用される。一例としては、ジヒドロキシアセトン、これは角質層における特定のアミノ酸と反応して色を与える。この種の製品の欠点は不均一な着色及び幾分不自然な赤褐色色素を生ずることである。

これらの製品に関連して経口的に摂取される人工日焼け化合物がある。一例としてカンタキサンチンがある。これらの化合物は表皮膚の下の脂肪細胞を着色することにより作用するようである。その様な製品も又不均一な日焼けを生じ、連続した維持投与を必要とする。ここでも又、これらの製品は有害の照射に対して何等の保護も与えない。

太陽保護のための最も通常の試剤は日焼け止めである。これらの試剤は化学的手段を介してそれらの効果を及ぼす。それらは紫外線が皮膚に浸透できないようにそれを吸収する。日焼け止めはユーザーに幾つかの問題を与える。例えば、それらは有効であるためには曝露時に皮膚表面になければならない。日焼け止めは予防的であるので太陽に当ることを予期しなければならない。最も有効であるためには、日焼け止めは皮膚上に連続した均一膜として存在しなければならない。その様な膜を皮膚表面に運ぶことは極めて困難であり、その膜を長時間に亘って維持することは殆んど困難である。日焼け止めは曝露時に皮膚の表面上に残存しなければならない。しかしながら、日焼け止めは汗をかくこと、或いは水泳により容易に擦り落され、洗い落され、又、皮膚中に浸透することによっても失なわれ得る。日焼け止め剤はしばしばそれぞれ主として日焼け或いは刺戟により皮膚及び目に炎症を引起す。日焼け止めに関するもう一つの問題はそれらの有効性が大きくなればなる程、日焼け応答が増々減少されることである。

UV-誘発損傷が起った後に、皮膚の外観を改良する方法が示唆されている。コラーゲンの湿潤化剤としての局所適用は一つのその様な方法である。その他の方法としてコラーゲン或いはジメチルポリシロキサンの注入を含むものである。更に別の方法は「化学的剥離」を起こすために皮膚に化学的調剤の適用を含むものである。

或いは又、UV-誘発損傷が起った後に皮膚を修復するための方法が示唆されている。一つのその様な方法は、米国特許4,603,146号明細書に開示されているようなレチン酸の皮膚への適用を含むものである。これらの方法のいずれも十分に有効であることが示されておらず又、殆んどが広範囲の且つ費用のかかる処理を含むものである。明らかに、UV照射により誘発される損傷は、それが起こる前に防止するのが、はるかによりよいことである。皮膚に対する短期及び長期UV損傷の両者に対して保護すると共に、同時に皮膚の日焼けを安全で便利な方法で可能にする光保護剤が最も理想的である。

トコフェロール(ビタミンE)は局所用組成物における光保護剤用として開示されている。例えば米国特許4,144,325号明細書参照。トコフェロールは日焼け応答を干渉することなしにUV-照射から皮膚を保護する作用をする。しかしながら、化粧品企業の経験は安全性問題特に酸化の問題を有することを示唆している。これらの問題に近づくために一つの良く用いられる手法はトコフェロールのエステルを含む組成物の配合を含むものであるが、これらのエステル類は通常トコフェロール自体よりもより安定である。米国特許4,248,861号明細書は、太陽照射の皮膚への悪影響を防止するための酢酸トコフェロール、コハク酸トコフェロール、プロピオン酸トコフェロール、及びオレイン酸トコフェロールの使用を開示する。米国特許4,000,276号明細書はオロチニ酸トコフェロールよりなる化粧品組成物を開示する。安息香酸、p-アミノ安息香酸及びp-ニトロ-安息香酸トコフェロールはヨーロッパ特許公開公報166,221号(Tuominen, 1986年1月2日公開)における日焼け止め用に開示されている。トコフェロールのリノール酸、ニコチン酸及び2-エチルヘキサン酸エステルは特開昭61-143,331号明細書の化粧品組成物用に開示されている。殆どのトコフェロールエステル類により提供される増大した配合安定性は不幸にして光保護効率の減少の損失をもたらす。明らかに、トコフェロールと同様に作用するが、しかし、安定性の問題のない光保護剤が最も好ましい。

紅斑を緩和するための抗炎症剤の局所的使用は公知である。ステロイド系抗炎症剤、非ステロイド系抗炎症剤、並びに「天然の」抗炎症剤例えば植物アロエベラの抽出物などを含有する組成物がその様な用途に開示されている。例えば米国特許4,185,100号明細書(ヒドロコルチゾン、デキサミタソン、ナプロキセン、ケトプロフェン、イブプロフェン)、米国特許4,338,293号明細書(ステロイド系抗炎症剤)、ロード(Law, et al.)、Br.J.Pharm., 59(4), 591-597(1977)(イブプロフェン);カイドベイ(Kaidbey)、J.Invest.Dermatology, 66, 153-156(1976)(インドメタシン);及びグルーバー等(Gruber et al.)、Clinical Pharm.and Therapeut.13(1), 109~113(1971)(アスピリン、フェノプロフェン)参照。紅斑を予防するためのUV曝露前の抗炎症剤の短期適用、並びに皮膚へのUV-誘発損傷を少なくするためのUV曝露後の適用が教示されている。

本発明の目的はその使用が太陽への曝露の急性(紅斑)及び慢性(光老化)効果の両者を防止する安定な形態の局所用組成物を提供することである。

本発明の目的は又、日焼け応答を妨害すること無しにこれらの太陽の悪影響を防止するための局所用組成物、清浄化組成物及び方法を提供することである。

更に本発明の目的は、皮膚中に浸透し、擦り落し、摩耗或いは洗い落しのより少ない光保護組成物を提供することである。

更に本発明の目的は、余り効率の損失なしにUV曝露に先立ち皮膚に適用することのできる光保護組成物を提供することである。

発明の概要 本発明は光保護的に有効量のソルビン酸トコフェロール及び安全且つ有効量の局所用担体を含んでなる局所用適用に有用な組成物に関する。

本発明は又、光保護的に有効量のソルビン酸トコフェロール、光保護的に有効量の日焼け止め剤及び安全且つ有効量の局所用担体を含んでなる局所用適用に有用な組成物に関する。

本発明は更に安全且つ光保護的に有効量のソルビン酸トコフェロールを皮膚を紫外線に照射させると共に皮膚に適用することよりなる紫外線曝露の皮膚への悪影響を抑制する方法に関する。

本発明は更に安全且つ光保護的に有効量のソルビン酸トコフェロール及び安全且つ光保護的に有効量の日焼け止め剤を皮膚を紫外線に曝露すると共に皮膚に適用することよりなる皮膚への紫外線曝露の悪影響を抑制する方法に関する。

発明の具体的説明活性剤 本発明はUV曝露の悪影響を防止するためのソルビン酸トコフェロールを含有する組成物の局所的使用に関する。ソルビン酸トコフェロールはソルビン酸のトコフェロールエステルである(より普通にはビタミンE)として知られている。

ソルビン酸トコフェロールは公知の標準的エステル化方法により合成することができる。トコールのモノメチル、ジメチル、或いはトリメチル誘導体を含むトコフェロール類の任意のものがエステル化に適したものである。より具体的には、アルファトコフェロール(5,7,8-トリメチルトコール)、ベータトコフェロール(5,8-ジチメルトコール)、ガンマトコフェロール(7,8-ジチメルトコール)、デルタトコフェロール(8-メチルトコール)、イブシロントコフェロール(5-メチルトコール)、ゼータトコフェロール(5,7-ジチメルトコール)、及びイータトコフェロール(7-メチルトコール)の任意のものを用いてソルビン酸トコフェロールがつくられる。これらの異性体のあるものは他のものよりも光保護により有効である。ベータ、ガンマ及びデルタトコフェロール類は特に強い抗-酸化特性を示し、従って、本発明の光保護剤を作製するのに好ましい。これらの異性体の混合物を用いて本発明に有用なソルビン酸トコフェロールが製られてもよい。

ソルビン酸トコフェロールは例えば先ず1モルのdl-アルファートコフェロールを約4.3モルのポリホスフェートエステルと組合わされることにより製られる。反応液に次いで1モルのソルビン酸を添加し、溶液を約16時間攪拌する。この試料を等容量の脱イオン水で洗浄し、等容量のジエチルエーテルを添加する。各層を分離し、有機層を8.7■の重炭酸ナトリウム(1Kg/12■の水)で洗浄する。4■の無水エーテルを添加して各相の分離を達成する。有機層を1Kgの無水硫酸ナトリウム上で乾燥する。有機画分を硫酸ナトリウムから傾瀉分離し、約50°C及び約30mmHgにおける回転蒸発により乾燥して約574gを得る。この試料を1■のヘキサンで洗浄し、固体或いは残存クロロホルムを除去する。この試料を乾燥して99%純度を越える約500gの黄色／褐色粘稠油状物を得る。

本発明の組成物においては安全且つ光保護的に有効量のソルビン酸トコフェロールが用いられる。「安全且つ光保護的に有効」量とは組成物が適当に適用された際に光保護を与えるに十分であるが、しかし、如何なる副作用或いは悪い皮膚反応を引起こさないのに十分な量を意味し、一般的には組成物の約1%～約20%、好ましくは約2%～約10%である。

ソルビン酸トコフェロールは非一日焼け止め光保護剤であることを注意することが重要である。日焼け止めは皮膚の表面上に作用して有害な光線が皮膚に入らないようにUV放射線を吸収するものである。ソルビン酸トコフェロールはおそらく皮膚内における損傷反応を防止するそのラジカル捕捉及び光化学反応消滅能力により皮膚の内部に作用するものである。ソルビン酸トコフェロールが皮膚に浸透して作用するので日焼け止めの有効性を弱める活性成分の擦り落し、摩滅或いは洗い落しなどは本発明とは本質的に無関係である。更に、日焼け止めに関しては重要であるが、本発明の活性成分の均一な被覆を全曝露時間に亘って保つ必要はない。ソルビン酸トコフェロールは皮膚にUV曝露前4時間以上まで適用することができる。ソルビン酸トコフェロールはUV曝露の急性の効果、例えは日焼け、及びUV曝露の慢性的効果、例えは皮膚の早期老化の両方に対して保護する。ラジカル捕捉剤としてソルビン酸トコフェロールの局所的使用は又日光に対して著しい感受性を有する人々にも有益である。その様な使用はこれらの皮膚障害を有する個人が日焼けすることを可能にする。

担体 活性剤 ソルビン酸トコフェロールに加えて、本発明の組成物は安全且つ有効量の許容可能な担体を含有する。「許容可能な局所用担体」という用語は薬学的に許容可能な担体及び化粧品的に許容可能な担体の両者を包含し、それは活性成分を皮膚に運ぶのに適した実質的に非刺戟性の適合性成分(単独或いは混合物のいずれでもよい)を包含する。茲に用いられる「適合性」という用語は担体の各成分がソルビン酸トコフェロールと及び相互に組成物の有効性を皮膚をUV照射の影響から保護するために使用する際に実質的に減少させる相互作用がないように混ぜ合わせることができなければならないことを意味する。これらの担体は勿論それらを人或いは低級動物の皮膚

への慢性的局所投与に適したものにするのに十分に高い純度及び十分に低い毒性のものでなければならない。担体の「安全且つ有効量」という用語はソルビン酸トコフェロールを皮膚に運ぶのに十分な量であるが、しかし、如何なる副作用或いは皮膚反応も引起こさない量を意味し、一般的に組成物の約50%～約99%、好ましくは約90%～約98%である。

これらの担体の配合における変化の効果、本発明の範囲内の各種製品が得られる。これらの製品のタイプは次の二つの群即ち薬品／化粧品組成物及び清浄化組成物に分けることができる。

薬品／化粧品組成物 本発明の薬品／化粧品組成物は広範な各種製品の種類に製られる。これらは例えばローション、クリーム、ビーチオイル、ゲル、スティック、スプレー、軟膏、ペースト、ムース、及び化粧品などが含まれる。これらの製品の種類は二つの基本的な担体系の種類即ち溶液及びエマルジョンのいずれかよりなるものである。

溶液として配合される本発明の薬品／化粧品組成物は薬学的に或いは化粧品的に許容可能な有機溶媒を典型的に含むものである。「薬学的に許容可能な有機溶媒」及び「化粧品的に許容可能な有機溶媒」という用語はその中にソルビン酸トコフェロールを分散或いは溶解することができることに加えて、又許容可能な安全性(例えば、刺戟及び増感特性)並びに良好な審美的性質(例、べとべと或いはねばねばした感じがない)を有する有機溶媒を示す。その様な溶媒の最も典型的な例はイソプロパノールである。その他の適当な有機溶媒の具体例としては次のものが挙げられる：プロピレンジリコール、ポリエチレンジリコール(200～600)、ポリプロピレンジリコール(425～2025)、グリセロール、1,2,4-ブタントリオール、ソルビトルエステル類、1,2,6-ヘキサントリオール、エタノール、ブタンジオール、水及びそれらの混合物。これらの溶液は約1%～約20%、好ましくは約2%～約10%のソルビン酸トコフェロール、及び約80%～約99%、好ましくは約90%～約98%の許容可能な有機溶媒を含有する。

本発明の薬品／化粧品組成物がエアロゾールとして配合され、皮膚にスプレーとして適用される場合には噴射剤が溶液組成物に添加される。茲で有用な噴射剤の具体例としては塩素化、フッ素化及び塩素-フッ素化低分子量炭化水素類が挙げられる。本発明において有用なその他の噴射剤としては低分子量炭化水素混合物(例、Phillips Petroleum Companyの子会社のPhillips Chemical Co.製のPropellant A46として商業的に知られているブタン、イソブタン及びプロパンの混合物)、エーテル類及びハロ炭化水素類例えばジメチルエーテル或いはジクロロジフルオロメタン単独或いはそれとジクロロテトラフルオロエタンとの混合物などが挙げられる。炭化水素及びハロ炭化水素噴射剤と亜酸化窒素との混合物も又用いられる。窒素及び二酸化炭素も又噴射ガスとして用いられる。それらは容器の内容物を放射するのに十分な割合で用いられる。茲で有用な噴射剤のより完全な開示内容は茲において準用するサガリン[Sagarin,Cosmetics Science and Technology、第2版、Vol.2、pp.443～465(1972)]に見ることができる。

或いは又、皮膚軟化剤は溶液として配合される本発明の担体系よりなってよい。この様にして配合される組成物の具体例はビーチオイル製品である。その様な組成物は約1%～約20%のソルビン酸トコフェロール、及び約2%～約50%の薬学的／化粧品的に許容可能な皮膚軟化剤を含有する。

茲に用いられる「皮膚軟化剤(emollient)」とは皮膚の乾燥の防止或いは緩和、並びに保護のために用いられる物質を指す。広範囲の各種の適当な皮膚軟化剤が公知であり、本発明において用いられる。茲に準用するサガリン[Sagarin,Cosmetics,Science and Technology、第2版、Vol.1、pp.32～43(1972)]は数多くの適当な物質の具体例を含んでいる。有用な皮膚軟化剤の群の具体例としては下記のものが挙げられる：1. 炭化水素油類及びワックス類。具体例として鉛油、ワセリン、パラフィン、セレシン、オゾケライト、微結晶ワックス、ポリエチレン、及びパーアイドロスクアレンなどが挙げられる。

2. シリコーンオイル類、たとえばジメチルポリシロキサン類、メチルフェニルポリシロキサン類、水溶性及びアルコール可溶性シリコーングリコール共重合体。

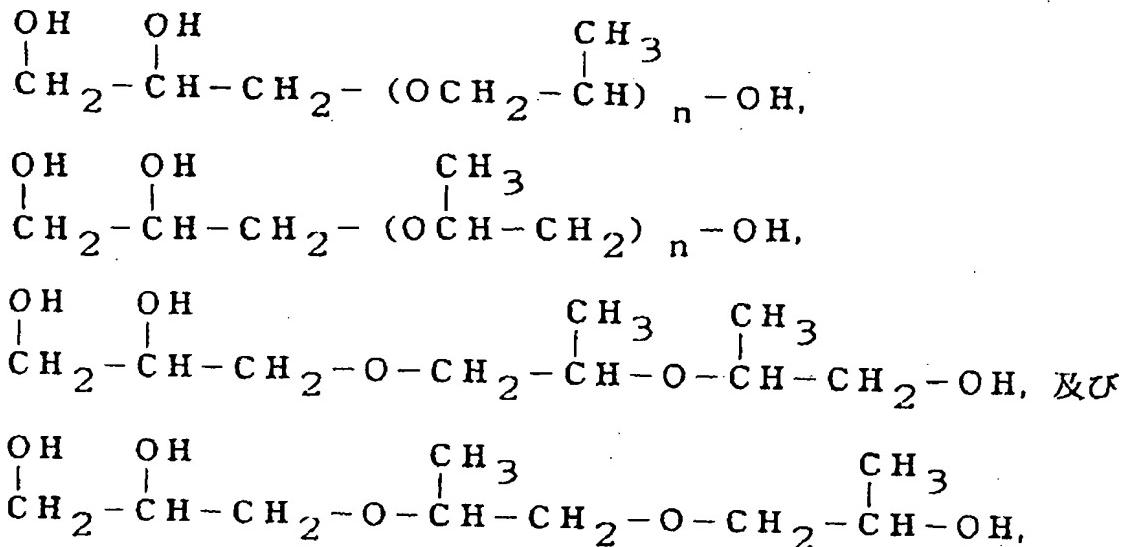
3. トリグリセリドエステル類、例えば植物及び動物油脂類。具体例としては、ヒマシ油、サフラワ油、綿実油、コーン油、オリーブ油、タラ肝油、アーモンド油、アボカド油、パーム油、ゴマ油及び大豆油などが挙げられる。

4. アセトグリセリドエステル類、例えばアセチル化モノグリセリド類。

5. エトキシリ化グリセリド類、例えばエトキシリ化グリセリルモノステアレート。

6. 10～20個の炭素原子を有する脂肪酸のアルキルエステル類。脂肪酸のメチル、イソプロピル、及びブチルエステル類が特に本発明で有用である。その他の有用なアルキルエステル類の具体例としてはヘキシリラウレート、イソヘキシリラウレート、イソヘキシリパルミテート、イソプロピルパルミテート、デシルオレエート、イソデシルオレエート、ヘキサデシルステアレート、デシルステアレート、イソプロピルイソステアレート、ジイソプロピルアジペート、ジイソヘキシリアジペート、ジヘキシリデ

- シルアジペート、ジイソプロピルセバケート、ラウリルラクテート、ミリスチルラクテート及びセチルラクテートが挙げられる。
7. 10～20個の炭素原子を有する脂肪酸のアルケニルエステル類。具体例としてはオレイルミリスティート、オレイルステアレート、及びオレイルオレエートが挙げられる。
 8. 10～20個の炭素原子を有する脂肪酸類。適当な具体例としては、ペラルゴン酸、ラウリン酸、ミリスチン酸、パルミチン酸、ステアリン酸、イソステアリン酸、ヒドロキシステアリン酸、オレイン酸、リノール酸、リシノール酸、アラキジン酸、ベヘン酸及びエルカ酸が挙げられる。
 9. 10～20個の炭素原子を有する脂肪アルコール類。ラウリル、ミリスチル、セチル、ヘキサデシル、ステアリル、イソステアリル、ヒドロキシステアリル、オレイル、リシノレイル、ビヘニル、及びエルシルアルコール類並びに2-オクチルドデカノールが満足できる脂肪アルコール類の具体例である。
 10. 脂肪アルコールエーテル類。10～20個の炭素原子のエトキシ化脂肪アルコール類としては1～50個のエチレンオキシド基或いは1～50個のプロピレンオキシド基を結合して有するラウリル、セチル、ステアリル、イソステアリル、オレイル及びコレステロールアルコール類が挙げられる。
 11. エトキシ化脂肪アルコール類の脂肪酸エステル類などのエーテルーエステル類。
 12. ラノリン及び誘導体。ラノリン、ラノリン油、ラノリンワックス、ラノリンアルコール類、ラノリン脂肪酸類、イソプロピルラノレート、エトキシ化ラノリン、エトキシ化ラノリンアルコール類、エトキシ化コレステロール、プロポキシ化ラノリンアルコール類、アセチル化ラノリン、アセチル化ラノリンアルコール類、ラノリンアルコール類リノレート、ラノリンアルコール類リシノレート、ラノリンアルコール類リシノレートのアセテート、エトキシ化アルコールーエステル類のアセテート、ラノリンの水素添加分解、エトキシ化水素添加ラノリン、エトキシ化ソルビトールラノリン、及び液体及び準固体ラノリン吸収塩基などがラノリンから誘導される皮膚軟化剤の具体例である。
 13. 多価アルコール類及びポリエーテル誘導体。プロピレングリコール、ジプロピレングリコール、ポリプロピレングリコール類2000及び4000、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレングリコール、ポリオキシプロピレンポリオキシエチレングリコール、グリセロール、ソルビトール、エトキシ化ソルビトール、ヒドロキシプロピルソルビトール、ポリエチレングリコール類200～6000、メトキシポリエチレングリコール類350、550、750、2000及び5000、ポリ[エチレンオキシド]単独重合体(100,000～5,000,000)、ポリアルキレングリコール及び誘導体、ヘキシレングリコール(2-メチル-2,4-ペンタジオール)、1,3-ブチレングリコール、1,2,6-ヘキサントリオール、エトキシサジオールUSP(2-エチル-1,3-ヘキサンジオール)、C₁₅-C₁₈ビシナルグリコール、及びトリメチロールプロパンのポリオキシプロピレン誘導体がこの群の物質の具体例である。
 14. 多価アルコールエステル類。エチレングリコールモノー及びジー脂肪酸エステル類、ジエチレングリコールモノー及びジー脂肪酸エステル類、ポリエチレングリコール(200～6000)モノー及びジー脂肪酸エステル類、ポリエチレングリコールモノー及びジー脂肪酸エステル類、ポリプロピレングリコール2000モノオレエート、ポリプロピレングリコール2000モノステアレート、エトキシ化プロピレングリコールモノステアレート、グリセリルモノー及びジー脂肪酸エステル類、ポリグリセロールポリ-脂肪酸エステル類、エトキシ化グリセリルモノステアレート、1,3-ブチレングリコールモノステアレート、1,3-ブチレングリコールジステアレート、ポリオキシエチレンポリオール脂肪酸エステル、ソルビタン脂肪酸エステル類、及びポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル類が茲において使用するに満足できる多価アルコールエステル類である。
 15. 蜜蠅、スパーームアセチル、ミリスチルミリスティート、ステアリルステアレートなどのワックスエステル類。
 16. 蜜蠅誘導体、例えばポリオキシエチレンソルビトール蜜蠅。これらはエーテルーエステル類の混合物を形成する蜜蠅と各種エチレンオキシド含量のエトキシ化ソルビトールとの反応生成物である。
 17. カルナウバ及びキャンデリラワックスなどを含む植物性ワックス類。
 18. リン脂質類例えばレシチン及び誘導体。
 19. ステロール類。コレステロール及びコレステロール脂肪酸エステルがその具体例である。
 20. 脂肪酸アミド類、エトキシ化脂肪酸アミド類、固体脂肪酸アルカノールアミド類などのアミド類。皮膚のコンディショニングを与える時に有用な皮膚軟化剤はグリセロール、ヘキサントリオール、ブタントリオール、乳酸及びその塩類、尿素、ピロリドンカルボン酸及びその塩類、アミノ酸類、グアニジン、ジグリセロール及びトリグリセロールである。好ましい皮膚コンディショニング剤は米国特許出願Serial No.023,059[オ一等(Orr et al.)、1987年3月6日出願]に開示されているプロポキシ化グリセロール誘導体である。これらのものは下記式から選ばれる式を有する：



(式中、 $n = 1$ 又は 2)

及びそれらの混合物。好ましくは、本発明の組成物は約1～約10重量%のこのプロポキシル化グリセロール誘導体を含んでなる。

ローションを溶液担体からつくることができる。ローション類は典型的には約1%～約20%、好ましくは約2%～約10%のソルビン酸トコフェロール、約1%～約20%、好ましくは約5%～10%の皮膚軟化剤及び約50%～約90%、好ましくは約60%～約80%の水よりなる。溶液担体系から配合されるもう一つの種類の製品はクリームである。本発明のクリームは約1%～約20%、好ましくは約2%～約10%のソルビン酸トコフェノール、約5%～約50%、好ましくは約10%～約20%の皮膚軟化剤及び約45%～約85%、好ましくは約50%～約75%の水よりなる。

溶液担体系から配合される更にもう一つの種類の製品は軟膏である。軟膏は動物或いは植物油或いは準固体炭化水素類(油性)の単純なベースを含んでなる。軟膏は又水を吸収してエマルジョンを形成する。吸収軟膏ベースを含んでもよい。その様な軟膏ベースの具体例としては無水ラノリン及び親水性ワセリンが挙げられる。エマルジョン軟膏ベースは水中油或いは油中水エマルジョンである。軟膏担体は又水溶性であってもよい。その様な軟膏担体の具体例としてはグリコールエーテル類、プロピレングリコール類、ポリオキシルステアレート類、及びポリソルベート類が挙げられる。軟膏は又約2%～約10%の皮膚軟化剤プラス約0.1%～約2%の増粘剤よりもよい。適當な増粘剤の具体例としては次のものが挙げられる：セルロース誘導体(例、メチルセルロース及びヒドロキシプロピルメチルセルロース)、合成高分子量重合体(例、カルボキシビニル重合体及びポリビニアルコール)、植物ハイドロコロイド類(例、カラヤガム及びトラガカントガム)、クレー増粘剤(例、コロイド状マグネシウムアルミニウムシリケート及びベントナイト)、及びカルボキシルビニル重合体(Carbopol^R—B.F.Goodrich Companyより販売、その様な重合体は本発明において準用する米国特許2,798,053号明細書に詳細に記載されている)。

本発明において有用な増粘剤のより完全な開示内容は本発明において準用するサガリン[Sagarin,Cosmetic.Science and Technology、第2版、Vol.1、pp.72～73(1972)]に見ることができる。担体系がエマルジョンとして配合される場合には、担体系の約1%～約10%、好ましくは約2%～約5%を乳化剤が占める。乳化剤は非イオン性、アニオン性、或いはカチオン性であってよい。適當な乳化剤は例えば米国特許3,755,560号、米国特許4,421,769号各明細書、及びマックチュッソン[McCutcheon,Detergents and Emulsifiers,North American Edition,pp.317～324(1986)]に開示されており、これらの開示内容は本発明において準用する。好ましい乳化剤はアニオン性或いは非イオン性であるがその他の種類も用いられてよい。

有用な非イオン性乳化剤の具体例としては、10～20個の炭素原子を有する脂肪アルコール類、2～20モルのエチレンオキシド或いはプロピレンオキシドと縮合された10～20個の炭素原子を有する脂肪アルコール類、2～20モルのエチレンオキシドと縮合されたアルキル鎖に6～12個の炭素原子を有するアルキルフェノール類、脂肪酸部分が10～20個の炭素原子を有するエチレングリコールのモノー及びジー脂肪酸エステル類、脂肪酸部分が10～20個の炭素原子を有する脂肪酸モノグリセリド

類、ポリエチレングリコール、200～6000の分子量のポリエチレングリコール類、200～3000の分子量のプロピレングリコール、ソルビトール、ソルビタン、ポリオキシエチレンソルビトール、ポリオキシエチレンソルビタン及び親水性ワックスエステル類である。その様な乳化剤の具体例としてはポリオキシエチレン(8)ステアレート、ミリストルエトキシ(3)ミリストート、ポリオキシエチレン(100)モノステアレート、ラウリン酸ジエタノールアミド、ステアリン酸モノエタノールアミド、水素添加植物グリセリド類、ナトリウムステアロイル-2-ラクチレート及びカルシウムステアロイル-2-ラクチレートが挙げられる。

適当なアニオン性乳化剤としては脂肪酸部分が10～20個の炭素原子を有する脂肪酸石けん、例えばナトリウム、カリウム、及びトリエタノールアミン石けんが挙げられる。その他の適当なアニオン性乳化剤としては、アルカリ金属、アンモニウム或いは置換アンモニウムアルキルサルフェート類、アルキルアリールスルホネート類、及びアルキル部分に10～30個の炭素原子を有するアルキルエトキシエーテルスルホネート類が挙げられる。アルキルエトキシエーテルスルホネート類は1～50個のエチレンオキシド単位を含有する。

本発明において有用なカチオン性乳化剤としては四級アンモニウム、モルホリニウム及びピリジニウム化合物が挙げられる。その様な乳化剤の具体例としてはジアルキル(C_{12} ～ C_{18})四級アンモニウム塩、セチルトリメチルアンモニウム塩、アルキルジメチルベンジルアンモニウム塩及びセチルピリジニウム塩が挙げられる。

水中油型及び油中水型のローション及びクリームなどの單一エマルジョン皮膚手入れ調剤は化粧品技術においてよく知られており、本発明において有用である。又、本発明において準用する米国特許4,254,105号明細書に開示されるような水中油中水型の多相エマルジョン組成物も本発明において有用である。一般的にその様な單一或いは多相エマルジョンは水、皮膚軟化剤及び乳化剤を必須成分として有用する。

米国特許出願Serial No.022,876号明細書[フィギエロア等(Figueroa et al.)、1987年3月6日出願、本発明において準用]に開示されるようなシリコーン中水中油流体エマルジョンよりなる三重重エマルジョン担体系も又本発明において有用である。より詳しくは、その様な三重重エマルジョン担体系は、a)(ビヒクルの)約15～約90重量%の少なくとも1種の液体有機ポリシロキサンにより本質的に構成されるシリコーン流体連続相、b)(ビヒクルの)約30～約80重量%の水相中に分散された化粧品的に許容可能な油状液体非粒状相の水中油エマルジョンよりなる水性不連続相、及びc)(ビヒクルの)約0.5～約5重量%の(b)を(a)に分散するのに有效分散量のジメチコンコポリオールよりなるものである。

該液体有機ポリシロキサンはジメチコンコポリオール、ジメチルポリシロキサン、ジエチルポリシロキサン、混合 C_1 ～ C_3 アルキルポリシロキサン、フェニルジメチコン及び約200,000～約1,000,000の平均分子量を有する高分子量ジメチコンよりなる群から選ばれる1種以上の非揮発性オルガノポリシロキサン類との混合物中におけるオクタメチルシクロテトラシロキサン、デカメチルシクロペニタシロキサン、ドデカメチルシクロヘキサシロキサン、シクロメチコン、及びヘキサメチルジシロキサンよりなる群から選ばれる1種以上の揮発性有機ポリシロキサンによりそれぞれ約5:1乃至約25:1の重量比で構成され、該油性相は重質鉱物油、コレステロール及びセチルパルミテートによりそれぞれ約10:5:1の重量比よりなる。

この三重重エマルジョン担体系を約1%～約20%、好ましくは約2%～約10%のソルビン酸トコフェロールと組合わせて本発明の薬品／化粧品組成物を得ることができる。

本発明の薬品／化粧品組成物に有用なもう一つのエマルジョン担体系はミクロエマルジョン担体系である。その様な系は約9%～約15%のスクアラン、約25%～約40%のシリコーン油、約8%～約20%の脂肪アルコール、約15%～約30%のポリオキシエチレンソルビタンモノー脂肪酸(Tweensの商品名で市販されている)、或いはその他の非イオン性物質、及び約7%～約20%の水よりなる。この担体系は約2%～約10%のソルビン酸トコフェロールと組合わされる。

ローション及びクリームは溶液と同様にエマルジョンとして配合することができる。典型的にはその様なローションは約1%～約20%、好ましくは約2%～約10%のソルビン酸トコフェロール、約1%～約20%、好ましくは約5%～約10%の皮膚軟化剤、約25%～約75%、好ましくは約45%～約95%の水、及び約1%～約10%、好ましくは約2%～約5%の乳化剤よりなる。その様なクリームは典型的には約1%～約20%、好ましくは約2%～約10%のソルビン酸トコフェロール、約1%～約20%、好ましくは約5%～約10%の皮膚軟化剤、約20%～約80%、好ましくは約30%～約70%の水、約1%～約10%、好ましくは約2%～約5%の皮膚軟化剤よりなる。

本発明の薬品／化粧品組成物がゲル或いは化粧品スティックとして配合される場合には上記に開示された適量の増粘剤がクリーム或いはローション配合物に添加される。

本発明の薬品／化粧品組成物は又ファンデーション或いは口紅などのメーキャップ製品としても配合される。ファンデーションは適量の増粘剤、顔料及び香料を有する溶液或いはローションベースのものである。口紅は着色剤をその中に分散したスティックを形成するのに十分に堅い油－ワックスベースにより本質的に構成される。

本発明の局所用薬品／化粧品組成物は前記成分に加えて通常局所用組成物に用いられる広範囲の付加的油溶性物質及び／又は水溶性物質をそれらの技術的に確立された割合で含有してよい。任意油溶性物質の中には非揮発性シリコーン流体、例えば25°Cにおいて約10～約100,000センチストークスの範囲の粘度を有するポリジメチルシロキサン類などがある。これらのシロキサン類は皮膚感触を高めるために有用であり、Dow Corning CorporationからDow Corning 200系列として市販されている。これらの任意の油溶性物質は全組成物の約20%まで好ましくは約10%までを占める。各種水溶性物質も又本発明の組成物中に存在してよい。これらには調湿剤例えはグリセロール、ソルビトール、プロピレングリコール、アルコキシル化グルコース及びヘキサントリオール、エチルセルロース、ポリビニルアルコール、カルボキシメチルセルロース、Veegum^R(マグネシウムアルミニウムシリケート、R.T.Vanderbilt,Inc.)などの植物性ガム類及びクレー類；タンパク質及びポリペプチド類；防腐剤例えはヒドロキシ安息香酸のメチル、エチル、プロピル及びブチルエステル類(パラベン類—Mallinckrodt Chemical Corporation)、EDTA、メチルイソチアゾリノン及びイミダゾリジニル尿素(Germall 115—Sutton Laboratories)；及び必要に応じて存在する脂肪酸或いは増粘剤の一部を中和するためのアルカリ剤例えは水酸化ナトリウム或いは水酸化カリウムなどが含まれる。加えて、本発明の局所用組成物は通常の化粧品用補助剤例えは染料、乳白剤(例、二酸化チタン)、顔料及び香料を含有することができる。

本発明の薬品／化粧品組成物は安全且つ有効量の浸透向上剤を含んでもよい。「安全且つ有効量」とはソルビン酸トコフェロールの皮膚中への浸透を高めるのに十分であるがしかし、如何なる副作用或いは皮膚反応を引起さない量を意味し、通常組成物の約1%～約5%である。有用な浸透向上剤の具体例は特に米国特許4,537,776号、4,552,872号、4,557,934号、4,130,667号、3,989,816号、4,017,641号各明細書及びヨーロッパ特許公開公報0043738号明細書に開示されている。米国特許4,537,776号明細書は、a)N-(2-ヒドロキシエチル)ピロリドン及びb)メチルラウレート、オレイン酸、オレイルアルコール、モノオレイン、ミリスチルアルコール、及びそれらの混合物から選ばれる細胞エンベロープ防害化合物により約1:5～約500:1の(a):(b)の重量比で本質的に構成される浸透向上ビヒクルを教示する。米国特許4,557,934号明細書は浸透向上剤1-ドデシルアザシクロヘプタン-2-オン、及び1,2-プロパンジオール、1,3-プロパンジオール、1,2-ブタンジオール、ピロリドン、1-(2-ヒドロキシエチル)-アザシクロペンタン-2-オン及びそれらの混合物よりなる群から選ばれる浸透向上ジオール或いはシクロケト化合物よりなる薬学的組成物を教示する。米国特許4,130,667号明細書は下記成分よりなる浸透向上剤を記載している：(a)少なくとも約0.1重量%のスクロースモノオクタノエート、スクロースモノデカノエート、スクロースモノラウレート、スクロースモノミリステート、スクロースモノパルミテート、スクロースモノステアレート、スクロースモノオレエート、及びスクロールジオレエートよりなる群から選ばれた糖エステル、及び(b)少なくとも約0.1重量%のオクチルジメチルホスフィンオキシド、ノニルジメチルホスフィンオキシド、デシルジメチルホスフィンオキシド、ウンデシルジメチルホスフィンオキシド、ドデシルジメチルホスフィンオキシド、2-ヒドロキシデシルジメチルホスフィンオキシド、及び2-ヒドロキシドデシルジメチルホスフィンオキシドよりなる群から選ばれたホスフィンオキシド化合物。

スルホキシド類もホスフィンオキシドの代りにある場合に用いられる。

本発明の組成物中にはその他の通常の皮膚手入れ製品添加剤が含まれてもよい。例えは、コラーゲン、ヒアルロン酸、エラスチン、加水分解物、プリムローズ油、ジョジョバ油、表皮成長因子、大豆サポニン類、ムコ多糖類、及びそれらの混合物が使用される。

各種ビタミン類も又本発明の組成物に含まれてよい。例えはビタミンA及びその誘導体、ビタミンB₂、ビオチン、パントテン酸、ビタミンD及びそれらの混合物が用いられる。

清浄化組成物 本発明の皮膚清浄化組成物はソルビン酸トコフェロールに加えて化粧品的に許容可能な界面活性剤を含んでなる。「化粧品的に許容可能な界面活性剤」という用語は単に有効な皮膚清浄化剤であるのみならず、又不当な毒性、刺戟、アレルギー性応答などなしに用いることのできる界面活性剤を指す。更にこの界面活性剤は組成物の皮膚をUV照射の影響から保護する有効性を実質的に減少させる相互作用のないようにソルビン酸トコフェロールと混ぜ合わすことのできるものでなければならない。

本発明の皮膚清浄化組成物は約1%～約25%、好ましくは約5%～約10%のソルビン酸トコフェロール、約1%～約90%、好ましくは約50%～約85%の化粧品的に許容可能な界面活性剤を含有する。

皮膚清浄化組成物の物理的形態は重要ではない。組成物は例えばトイレット棒、液体、ペースト或いはムースとして配合することができる。トイレット棒は最も普通に皮膚を洗浄するために用いられる清浄化剤の形態であるので最も好ましい。

本発明の組成物の界面活性剤成分はアニオン性、非イオン性、双性イオン性、双極及び両性界面活性剤、並びにそれらの界面活性剤の混合物から選ばれる。その様な界面活性剤は洗剤技術の当業者には周知のものである。

最も普通の種類のアニオン性界面活性剤は広く有機イオウ反応生成物の水溶性塩特にアルカリ金属塩として説明されており、それらの生成物は分子構造中に約8個～約22個の炭素原子を含有するアルキル基、及びスルホン酸及び硫酸エステル基よりなる群から選ばれる基を有する。これらの界面活性剤の重要な具体例はナトリウム、アンモニウム或いはカリウムアルキルサルフェート類、特に獣脂或いはヤシ脂のグリセリド類を還元することにより製造される高級アルコール類を硫酸化することにより得られるもの、アルキル基が約9～約15個の炭素原子を含有するナトリウム或いはカリウムアルキルベンゼンスルホネート類、特に本発明において準用する米国特許2,220,099号及び2,477,383号各明細書に記載されるタイプのもの、ナトリウムアルキルグリセリルエーテルスルホネート類、特に獣脂及びヤシ脂から得られる高級アルコール類のエーテル類、ナトリウムヤシ油脂脂肪酸モノグリセリドサルフェート及びスルホネート類1モルの高級脂肪アルコール(獣脂或いはヤシ油アルコール類及び約3モルのエチレンオキシドとの反応生成物の硫酸エステルのナトリウム或いはカリウム塩、約3モルのエチレンオキシドとのアルキルフェノールエチレンオキシドエーテルサルフェートのナトリウム或いはカリウム塩、アルキルフェノールエチレンオキシドのナトリウム或いはカリウム塩、分子当り約4単位のエチレンオキシドとのアルキルフェノールエチレンオキシドエーテルサルフェートのナトリウム或いはカリウム塩でアルキル基が約9個の炭素原子を含むもの、イセチオン酸でエステル化され水酸化ナトリウムで中和された脂肪酸の反応生成物であり、例えば脂肪酸がヤシ油から得られたもの、メチルタウリンの脂肪酸アミドのナトリウム又はカリウム塩であって、脂肪酸が例えばヤシ油から得られたもの、及びその他本発明において準用する米国特許2,486,921号、2,486,922号及び2,396,278号各明細書に具体的に示されるような公知のものが挙げられる。

一つの重要な有用なアニオン性界面活性剤の種類は石けんである。本発明の組成物において界面活性剤として用いることのできる石けんとしては約8～約24、好ましくは約10～約20の炭素原子を含有する脂肪酸のアルカリ金属(例、ナトリウム又はカリウム)石けんが挙げられる。これらの石けんを作成する際に用いられる脂肪酸は例えば植物或いは動物由来のグリセリド類(例、パーム油、ヤシ油、ババッス油、大豆油、ヒマシ油、獣脂、鯨脂、魚油、グリース、ラード及びそれらの混合物)などの天然資源から得ることができる。これらの脂肪酸は又合成により製造することができる(石油原料の酸化或いはFisher-Tropsch法)。

アルカリ金属石けんは油脂の直接けん化或いは別の製造方法において製造された遊離脂肪酸の中和により作ることができる。特に有用なのはヤシ油及び獣脂から得られた脂肪酸の混合物のナトリウム及びカリウム塩即ちナトリウム及びカリウム獣脂及びヤシ石けんである。

茲に脂肪酸混合物に関して用いられる「獣脂」という用語は典型的には2.5%C₁₄、29%C₁₆、23%C₁₈、2%パルミトール酸、41.5%オレイン酸及び3%リノール酸(最初の三つの脂肪酸は飽和である)の炭素鎖分布を有する脂肪酸を指す。同様な分布を有するその他の混合物、例えば各種動物の獣脂及びラードから選ばれる脂肪酸も又獣脂の用語内に含まれる。獣脂は又硬化(即ち水素添加)されて不飽和脂肪酸部分の一部或いは全部を飽和脂肪酸部分に転換することができる。

茲に用いられる「ヤシ油」という用語は、典型的には約8%C₈、7%C₁₀、48%C₁₂、17%C₁₄、9%C₁₆、2%C₁₈、7%オレイン酸及び2%リノール酸(最初の六つの脂肪酸は飽和である)の炭素鎖長分布を有する脂肪酸混合物を指す。同様な炭素鎖長分布を有する資源例えばパーム穀油、ババッス油も又ヤシ油の用語に含まれる。

非イオン性界面活性剤はアルキレンオキシド基(親水性)と脂肪族或いはアルキル芳香族である有機疎水性化合物との縮合により製造される化合物と広く定義される。任意の特別の疎水性基と縮合される親水性即ちポリオキシアルキレン基の長さは親水性及び疎水性要素間に所望程度の均衡を有する水溶性化合物を得るように容易に調製することができる。

例えば周知の非イオン性界面活性剤群はBASF Wyandotte CorporationによりPluronicの商品名の下に市販されている。これらの化合物はエチレンオキシドとプロピレンオキシドをプロピレングリコールと縮合して形成される疎水性ベースと縮合することにより形成される。勿論、水不溶性を示す分子の疎水性部分は約1500～約1800の分子量を有する。ポリオキシエチレン基のこの疎水性部分への添加は分子全体の水溶性を増大する傾向を示し、生成物の液体特性はポリオキシエチレン含量が縮合生成物の全重量の約50%になる点まで保持される。

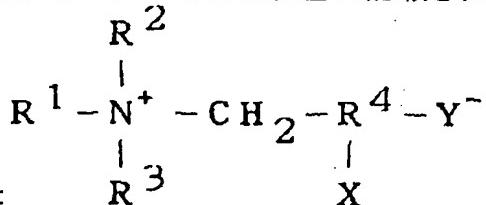
その他の適当な非イオン性界面活性剤としては例えば下記のものが挙げられる：(i)アルキルフェノール類のポリエチレンオキシド縮合物、例えば約6～約12個の炭素原子を直鎖或いは分岐鎖立体配置で含有するアルキル基を有するアルキルフェノールとエチレンオキシドとの縮合生成物であって、該エチレンオキシドがアルキルフェノールのモル当り約5～約25モルのエチレンオキシドに等しい量で存在するもの。その様な化合物におけるアルキル置換基は例えば重合されたプロピレン、ジイソブチレン、オクタン及びノナンから誘導される。この種類の化合物の具体例としてはフェノールのモル当り約9.5モルのエチレンオキシドと縮合されたノニルフェノール、フェノールのモル当り約12モルのエチレンオキシドと縮合されたドデシルフェノール、フェノールのモル当り約15モルのエチレンオキシドと縮合されたジノニルフェノール、及びフェノールのモル当り約15モルのエチレンオキシドと縮合されたジイソオクチルフェノールなどが挙げられる。この種の市販の非イオン性界面活性剤としてはGAF Corporationにより市販されているIgepal CO-630、及び全てRohm & Haas Companyにより市販されているTriton X-45、X-114、X-100及びX-102などが挙げられる。

(ii)エチレンオキシドと組成が所望とされる疎水性及び親水性要素間のバランスに応じて変えられるプロピレンオキシドとエチレンジアミン生成物の反応から得られる生成物との縮合から得られるもの。具体例としては約40～約80重量%のポリオキシエチレンを含有し、約5000～約11,000の分子量を有するエチレンオキシド基とエチレンジアミンと過剰プロピレンオキシドの反応生成物により形成される疎水性塩基であって、2500～3000のオーダーの分子量を有する塩基との反応から得られる化合物である。ここ種の非イオン性界面活性剤の具体例としてはWyandotte Chemical Corporationにより市販されているテトロニック化合物のある種のものが含まれる。

(iii)8～18個の炭素原子を直鎖或いは分岐鎖立体配置で有する脂肪族アルコールとエチレンオキシドとの縮合生成物例えばヤシアルコールのモル当り10～30モルのエチレンオキシドを有するヤシアルコールエチレンオキシド縮合物。この種の市販の非イオン性界面活性剤の具体例としてはUnion Carbide Corporationから市販されているTergitol 15-S-9($C_{11}-C_{15}$ 二級アルコールと9モルのエチレンオキシドとの縮合生成物)、Shell Chemical Companyから市販されているNeodol 45-9($C_{14}-C_{15}$ 線状アルコールと9モルのエチレンオキシドとの縮合生成物)、Neodol 45-7($C_{14}-C_{15}$ 線状アルコールと7モルのエチレンオキシドとの縮合生成物)、Neodol 45-4($C_{14}-C_{15}$ 線状アルコールと4モルのエチレンオキシドとの縮合生成物)、及びThe Procter & Gamble Companyにより市販されているKyro EOB($C_{13}-C_{15}$ 線状アルコールと9モルのエチレンオキシドとの縮合生成物)などが挙げられる。

(iv)一つのアルキル基が10～18個の範囲の炭素原子を有し、二つのアルキル基が1～3個の炭素原子を有し、アルキル基がヒドロキシ置換基を含有し得るトリアルキルアミノキシド類及びトリアルキルホスフィンオキシド類。具体例としてはドデシル(ジ-2-ヒドロキシエチル)アミノキシド及びテトラデシルジメチルホスフィンオキシドなどが挙げられる。

双性イオン界面活性剤は分子が広範囲のpH値に亘って分子にカチオン性及びアニオン性の両方の親水性基を与える内部塩を形成する塩基性基及び酸性基の両者を含有するベタイン及びベタイン-1様化合物よりなる。これらの界面活性剤の幾つかの普通の具体例が茲に準用する米国特許2,082,275号、2,702,279号、及び2,555,082号各明細書に記載されている。適当な双性イオン界面活



性剤は下記一般式を有する：

(式中、 R^1 は約8～約22個の炭素原子を含有するアルキル基であり、 R^2 及び R^3 は約1～約3個の炭素原子を含有し、 R^4 は約1～約4個の炭素原子を含有するアルキレン鎖であり、Xは水素及びヒドロキシ基よりなる群から選ばれ、Yはカルボキシル基及びスルホニル基よりなる群から選ばれ、且つ R^1 、 R^2 及び R^3 基の合計は約14～約26個の炭素原子である)。

系のpHに応じてカチオン性或いはアニオン性であり得る双極性及び両性界面活性剤はドデシル-ベーターアラニンのような洗剤、米国特許2,658,072号明細書の教示に従ってドデシルアミンをナトリウムイセチオネートと反応させることにより調製されるもののようなN-アルキルタウリン類、米国特許2,438,091号明細書の教示に従って製造されるものなどのN-高級アルキルアスパラギン酸類、及び米国特許2,528,378号明細書に記載されMiranolの商品名で販売されている製品などが挙げら

れ、これらの特許は茲に準用する。

本発明において有用な追加の界面活性剤は茲に準用するMcCutcheonのDetergents and Emulsifier(North American編、317～324頁、1986年)に見ることができる。

本発明の清浄化組成物は任意にそれらの技術的に確立された割合で皮膚清浄化組成物に通常用いられる物質を含有することができる。

通常の抗菌剤及び消毒剤は皮膚清浄化組成物内に約0.5～約4%の割合で含ませることができる。茲に用いるのに適した典型的な抗菌消毒剤としては3,4-ジー及び3,4',5'一トリープロモサリチルアニリド類、4,4'-ジクロロ-3-(トリフルオロメチル)カルブアニリド、3,4,4'-トリクロロカルブアニリド及びこれらの物質の混合物などが挙げられる。これら及び関連物質の皮膚清浄化組成物における使用により詳細に茲に準用する米国特許3,256,200号明細書に記載されている。

非イオン性皮膚軟化剤は本発明の皮膚清浄化組成物内に皮膚コンディショニング剤として約10%までの割合で含ませることができる。その様な物質としては例えば鉛物油、約100°F～約170°Fの融点を有するパラフィンワックス、脂肪ソルビタンエステル類(茲に準用する米国特許3,988,255号明細書参照)、ラノリン及びラノリン誘導体、イソプロピルミリストートなどのエステル類、及びヤシ油或いは水素添加獸脂などのトリグリセリド類などが挙げられる。

ヤシ油脂肪酸などの遊離脂肪酸などは本発明の組成物に約10%までの割合で添加して組成物により生成される泡の容量及び品質(クリームらしさ)を改良することができる。

香料、染料、顔料も又本発明の皮膚清浄化組成物中に導入することもできる。香料は約0.5%～3%の割合で用いるのが好ましく、染料及び顔料は約0.001%～約0.5%の割合で用いるのが好ましい。

特に好ましい任意成分はカチオン性或いは非イオン性重合体皮膚感触助剤である。両種類の重合体の減少した皮膚刺戟の利益はUnion Carbideによる「皮膚手入れのためのポリマーJR(Polymer JR for Skin Care)」(1977年)に示されている。本発明において用いるには、カチオン性重合体の方がより良好な皮膚感触利益を与えるので非イオン性重合体より好ましい。この目的に有用なカチオン性重合体及び非イオン性重合体の具体例は以下に示される。

本発明において有用であることが判明した重合体皮膚感触助剤の量は組成物の約0.5%～約5%、好ましくは約0.1%～約2%、より好ましくは約0.1%～約1%である。

特に好ましい皮膚感触助剤はカチオン性(四級化)グアガム、例えばCelanese Corp.からのJaguar C-14-Sである。

本発明において有用なその他の種類の高分子量重合体皮膚感触剤としては非イオン性グアガム類、Merck & Co.Inc.により作られるMerquat 100及び550;Union Carbide Corp.により作られるUCARE重合体JR-400;Miranol Chemical Company,Inc.により作られるMirapol A15;及びHenkel Inc.により作られるGalactasol 811などが挙げられる。

皮膚感触助剤として有用であることが判明した非イオン性重合体としては非イオン性多糖類、例えばCelanese Corp.の一部門であるCelanese Water Soluble Polymersにより販売されている非イオン性ヒドロキシプロピルグアガム類などが挙げられる。好ましい非イオン性ヒドロキシプロピルグアガム物質は約0.6のヒドロキシプロピルモル置換率を有するJaguar^RHP-60である。もう一つの有用な非イオン性皮膚感触助剤としてはセルロース非イオン性重合体、例えば、ヒドロキシエチルセルロース及びカルボキシメチルセルロースが挙げられる。

上記成分に加えて、任意の調湿剤、増粘剤、防腐剤、アルカリ性剤、皮膚コンディショニングプロポキシル化グリセロール誘導体或いは化粧品補助剤も又皮膚清浄化組成物に用いられる。

トイレット石けん棒として配合される皮膚清浄化剤は、通常、約50%～約90%の界面活性剤よりもなる。水分は通常約5%～約20%の割合で存在する。液体として配合される皮膚清浄化組成物は通常約10%～約30%の界面活性剤及び約60%～約90%の水よりもなる。ペーストとして配合される皮膚清浄化組成物は通常約20%～約60%の界面活性剤及び約30%～約50%の水よりもなる。ペースト及び液体は又通常天然ガム類及び重合体などの有機増粘剤を含有する。

石けんベーストイレット棒組成物の具体例は茲に準用する米国特許3,567,749号明細書に見られる。本発明の組成物を調製する際に用いることのできる合成ペーストイレット棒の具体例は茲に準用する米国特許2,987,484号明細書に見られる。その他の石けん／合成ペーストイレット棒の具体例は茲に準用する米国特許3,070,547号及び3,376,229号各明細書に見られる。本発明の液体組成物を製造する際に用いることのできる石けんベース液体清浄化組成物の具体例は茲に準用する米国特許4,310,433号明細書に見られる。本発明の組成物を調製する際に用いることのできる合成ペース液体清浄化組成物の具体例は茲に引用する米国特許4,338,211号明細書に見られる。ペースト組成物は米国特許4,310,433号及び4,338,211号各明細書の組成物における水の割合を適当に減少させることにより作ることができる。

本発明の皮膚清浄化組成物は又加圧エアロゾルムース組成物に配合することもできる。ムース組成物は約88%～約97%、好ましくは約90%～約96%の溶液型の配合物(濃縮されたもの)、及び約3%～約12%、好ましくは約4%～約10%の噴射剤を含有する。これらの組成物において有用な好ましい界面活性剤は茲に準用するヨーロッパ特許公開公報0194097号(Schmidt et al.1986年9月10日公開)に記載されている。特に好ましい噴射剤はPhillips Petroleum Companyの子会社であるPhillips Chemical Companyにより作られているPropellant A46として商業的に知られているブタン、イソブタン及びプロパンの混合物である。

本発明の皮膚清浄化組成物は好ましくは又洗い落しを防止し、皮膚へのソルビン酸トコフェノールの沈積を確実にするための固着剤も含んでなる。適当な固着剤はグーガム及びPolymer JRである。

組合せ活性剤日焼け止め 日光の損傷に対する最適の保護は本発明の非一日焼け止め光保護剤と日焼け止めの組合せを用いることにより得ることができる。ソルビン酸トコフェロールの光保護能力は主としてUVB放射に対するものである。即ち、ソルビン酸トコフェロールとUVA日焼け止めの組合せが最も望ましいものである。追加のUVB保護も又その様な組成物内に含まれてもよい。本発明の組成物中の日焼け止めの低割合の包含はユーザーの日焼け応答を余り減少させないであろうが、しかし、急性UV損傷に対する即時の保護を高めるであろう。

広範囲の各種通常の日焼け止め剤がソルビン酸トコフェロールと組合せて使用するのに適したものである。Segarin等のCosmetic Science and Technologyの第8章、189頁以降は数多くの適当な日焼け剤を開示している。具体的な適当な日焼け止め剤としては例えば次のものが挙げられる:p-アミノ安息香酸、その塩及びその誘導体(エチル、イソブチル、グリセリル、エステル類;p-ジメチルアミノ安息香酸);アントラニレート類(即ち、o-アミノベンゾエート;メチル、メンチル、フェニル、ベンジル、フェニルエチル、リナリル、ターピニル及びシクロヘキセニルエステル類);サリチレート類(アミル、フェニル、ベンジル、メンチル、グリセリル、及びジプロピレングリコールエステル類);桂皮酸誘導体(メンチル及びベンジルエステル類、 α -フェニルシンナモニトリル;ブチルシンナモイルピルベート);ジヒドロキシ桂皮酸誘導体(ウンベリフェロン、メチルウンベリフェロン、メチルアセト-ウンベリフェロン);トリヒドロキシ桂皮酸誘導体(エスクレチン、メチルエスクレチン、ダフチネン、及びグルコシド類、エスクリン及びダフニン);炭化水素類(ジフェニルブタジエン、スチルベン)ジベンザルアセトン及びベンザルアセトフェノン;ナフトールスルホネート類(2-ナフトール-3,6-ジスルホン酸及び2-ナフトール-6,8-ジスルホン酸のナトリウム塩);ジヒドロキシナフトエ酸及びその塩;o-及びp-ヒドロキシビフェニルジスルホネート類;クマリン誘導体(7-ヒドロキシ、7-メチル、3-フェニル);ジアゾール類(2-アセチル-3-ブロモインダゾール、フェニルベンゾキサゾール、メチルナフトキサゾール、各種アリールベンゾチアゾール類)キニン塩(バイサルフェイト、サルフェート、クロライト、オレエート及びタンネート);キノリン誘導体(8-ヒドロキシキノリン塩、2-フェニルキノリン);ヒドロキシー或いはメトキシー置換ベンゾフェノン類;尿素及びビロ尿酸;タンニン酸及びその誘導体(例、ヘキサエチルエーテル);(ブチルカービンチル)(6-プロピルピペロニル)エーテル;ハイドロキノン;ベンゾフェノン類(オキシベンゼン、スリソベンゾン、ジオキシベンゾン、ベンゾレゾルシノール、2,2',4,4'-テトラヒドロキシベンゾフェノン、2,2'-ジヒドロキシ-4,4'-ジメトキシベンゾフェノン、オクタベンゾン;4-イソプロピルビベンゾイルメタン;ブチルメトキシジベンゾイルメタン;エトクリレン;及び4-イソプロピルージベンゾイルメタン)。

これらのうち、2-エチルヘキシルp-メトキシシンナメート、4,4'-t-ブチルメトキシジベンゾイルメタン、2-ヒドロキシ-4-メトキシベンゾフェノン、オクチルジメチルp-アミノ安息香酸、ジガロイルトリオレエート、2,2-ジヒドロオキシ-4-メトキシベンゾフェノン、エチル4-[ビス(ヒドロキシプロピル)]アミノベンゾエート、2-エチルヘキシル2-シアノ-3,3-ジフェニルアクリレート、2-エチルヘキシルサリチレート、グリセリルp-アミノベンゾエート、3,3,5-トリメチルシクロヘキシルサリチレート、メチルアントラニレート、p-ジメチルアミノ安息香酸或いはアミノベンゾエート、2-エチルヘキシルp-ジメチルアミノベンゾエート、2-フェニルベンズイミダゾール-5-スルホン酸、2-(p-ジメチルアミノフェニル)-5-スルホニックベンズオキサエ酸及びこれらの化合物の混合物が特に有用である。

本発明の組成物に有用な好ましい日焼け止め剤は2-エチルヘキシルp-メトキシシンナメート、ブチルメトキシジベンゾイルメタン、2-ヒドロキシ-4-メトキシベンゾフェノン、オクチルジメチルp-アミノ安息香酸及びそれらの混合物である。

本発明のソルビン酸トコフェロール組成物には安全且つ光保護的に有効量の日焼け止めが使用される。「安全且つ光保護的」とは組成物が適用された際に光保護を与えるのに十分であるが、しかし、如何なる副作用或いは皮膚反応も引起す程多くはない量を意味する。日焼け止め剤は又ソルビン酸トコフェロールと相溶性でなければならない。「相溶性」とは日焼け止め剤が光保護用の組成

物の有効性を実質的に減少させる相互作用がないようにソルビン酸トコフェロールと混ぜ合わせることができなければならないことを意味する。通常組成物の約1%～約20%、好ましくは約2%～約10%を日焼け止め剤が占める。正確な量は選ばれた日焼け止め剤及び所望の日光保護因子(SPF)に応じて異なる。

SPFは紅斑に対して通常用いられる日焼け止め剤の光保護の目安である。この数はもう一つのパラメータ、最少紅斑投与量(MED)から得られる。MEDは「遅延紅斑応答を顕在化させる特定波長における最小曝露量」と定義される。このMEDは皮膚に到達するエネルギーの量及び放射線に対する皮膚の応答性を示す。特別の光保護剤のSPFは保護皮膚のMEDを未保護皮膚のMEDで除することにより得られる。SPFが高ければ高い程、日焼け止め剤の日焼け防止の有効性がより大きい。このSPF値はある人が1MEDを経験する前に(未保護皮膚を有する人と対比して)日焼け止め剤を用いて日光中に何倍長く滞在できるかを物語る。例えば、6のSPFを有する日焼け止め剤を利用するとある個人を1MEDを受取る前に日光中に6倍の長さ滞在させることを可能にする。日焼け止め剤のSPF値が増大するにつれて、皮膚の日焼けの発達の機会がより少なくなる。市販の日焼け止め製品は2～34のSPF値を有する。

ソルビン酸トコフェロールの紅斑に対する光保護能力も又測定することができる。ソルビン酸トコフェロールはSPF-2日焼け止め剤と等価の紅斑減少を与える。SPF-2日焼け止め剤がソルビン酸トコフェロールと共に日焼けに対する保護のために用いられる場合には、この組合せはSPF-4日焼け止めと等価の保護を与える。

ソルビン酸トコフェロールの使用によりUV曝露の長期間の影響例えは皮膚の早期老化に対して達成される利益を測定することははるかに困難である。光一誘発された皮膚のしわ形成を測定する一方法が「太陽老化皮膚の動物モデル:UV-照射された毛のないマウス皮膚における組織学的、物理学的可視変化(An Animal Model of Solar-Aged Skin:Histological,Physical, and Visible Changes in UV-irradiated Hairless Mouse Skin)」ビセット等[(Bissett et al.)、Photochem Photobiol., 46 pp.367-378(1987)]に開示されている。

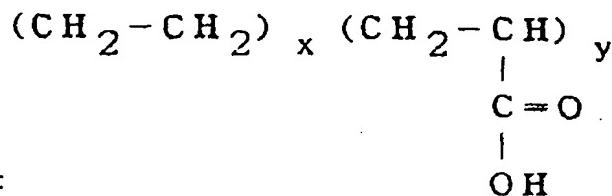
又、本発明においては、サバテリ(Sabatelli)、米国特許出願Serial No.054,085(1987年6月2日出願)及びサバテリ等、米国特許出願Serial No.054,046(1987年6月2日出願)に開示されるような日焼け止め剤が特に本発明において有用である。その中に開示される日焼け止め剤は単一分子内に異なった紫外線吸収スペクトルを示す二つの異なった発色団部分を有する。これらの発色団部分の一方は主としてUVB放射範囲において吸収し、他方は強くUVA放射範囲において吸収する。これらの日焼け止め剤は通常の日焼け止め剤に対してより高い効率、より広いUV吸収、より低い皮膚浸透性及びより長い持続効力を与える。

この群の日焼け止め剤の好ましい群は2,4-ジヒドロキシベンゾフェノンの4-N,N-(2-エチルヘキシル)メチルアミノ安息香酸エステル、4-ヒドロキシジベンゾイルメタンとのN,N-ジ-(2-エチルヘキシル)-4-アミノ安息香酸エステル、4-ヒドロキシベンゾイルメタンとの4-N,N-(2-エチルヘキシル)メチルアミノ安息香酸エステル、2-ヒドロキシ-4-(2-ヒドロキシエトキシ)ベンゾフェノンの4-N,N-(2-エチルヘキシル)メチルアミノ安息香酸エステル、4-(2-ヒドロキシエトキシ)ジベンゾイルメタンの4-N,N-(2-エチルヘキシル)メチルアミノ安息香酸エステル、2-ヒドロキシ-4-(2-ヒドロキシエトキシ)ベンゾフェノンのN,N-ジ-(2-エチルヘキシル)-4-アミノ安息香酸エステル、及び4-(2-ヒドロキシエトキシ)ジベンゾイルメタンのN,N-ジ-(2-エチルヘキシル)-4-アミノ安息香酸エステル及びそれらの混合物などである。

本発明の組成物は日焼け止め剤と共に或いはそれ無しに又シャンプー、コンディショナー、ムースその他の整髪製品としても配合される。UV放射線は髪を損傷することが知られており、本発明の光保護剤はその様な損傷を最小にする。更に、その様な配合は本発明の光保護剤をやはりUV損傷されやすい頭皮へ適用するための手段を提供する。任意の適合性のある技術上認識されている整髪配合物を約1%～約5%の割合で添加されるソルビン酸トコフェロールと共に用いることができる。

必要に応じて日焼け止めも又約1%～約5%で含まれられてもよい。

本発明の任意の組成物にそれらの組成物の皮膚固着性を改良するための、特に水による流出或いは擦り落しに対する耐性を高めるための試剤も添加されてもよい。この利益を与える好ましい試剤はエチレンとアクリル酸の共重合体である。この共重合体よりなる組成物は茲に準用する米国特許4,663,157号明細書に開示されている。開示された皮膚固着剤は二つの单量体エチレン及びアク



リル酸の重合体状態よりなり下記のものを与える：

(式中、x対yの比は約1:24乃至約1:9であり、分子の重量平均分子量は約3500～約4500、好ましくは約4000～約4300である)。

これらの共重合体はa)約1%～約20%のソルビン酸トコフェロール+任意の油溶性日焼け止め剤;b)約0.25%～約3%の上記エチレンーアクリル酸共重合体;c)約2%～約10%の乳化剤;及びd)約70%～約90%の水よりなる水中油エマルジョン日焼け止め組成物であって、光保護剤対共重合体の比が約12:1～約15:1であるものに含まれるのが好ましい。これらの共重合体と組合わせて特に有用な日焼け止め剤は2-エチルヘキシルp-メトキシシンナメート、ブチルメトキシジベンゾイルメタン、2-ヒドロキシー4-メトキシベンゾフェノン、オクチルジメチルp-アミノ安息香酸及びそれらの混合物である。

抗一炎症剤 本発明の好ましい光保護組成物においては、抗炎症剤がソルビン酸トコフェロールと共に活性剤として含まれる。抗炎症剤の包含は組成物の光保護利益を高めるものである。抗炎症剤はUVA放射領域において強く保護する(それらは幾らかのUVB保護も又与えるが)のに対し、ソルビン酸トコフェロールはUVB放射領域において強く保護する。この様に、この組合せは広範囲の保護を与える。UV放射線に対する急性曝露の効果即ち紅斑を減少させる抗炎症剤の局所的使用は公知である。しかしながら、本発明において抗炎症剤の慢性的な使用も又UV放射に対する慢性的な曝露より生ずる光老化を大きく減少させることができた。又抗炎症剤とソルビン酸トコフェロールの組合せが各活性成分単独により与えられるよりもより大きな光保護を与えることも発見された。更にこの組合せは各活性成分単独の効果の合計により提供されるよりもより大きな光保護を与える。より大きな光保護とはUV曝露の急性効果即ち紅斑の減少、及びUV曝露の慢性的効果例えば皮膚の早期しわ形成及びたるみなどの減少の両方を意味する。

安全且つ光保護的に有効量の抗炎症剤が本発明の組成物に添加される。「安全且つ光保護的に有効」な量とは組成物が適当に適用された場合に光保護を与えるに十分であるが、しかし、如何なる副作用或いは悪い皮膚反応を引起こす程多くはない量を意味し、通常組成物の約0.1%～約10%、好ましくは約0.5%～約5%である。組成物中に用いられる抗炎症剤の正確な量はその様な抗炎症剤は強度が広範に変わるので利用される特別の抗炎症剤に応じて異なる。

ステロイド系抗炎症剤を挙げると、コルチコステロイド類例えはヒドロコルチゾン、ヒドロキシトリアノムシノロン、アルファーメチルデキサメタゾン、デキサメタゾン-ホスフェート、ベクロメタゾンジプロピオネート、クロベタゾールバレレート、デソニド、デソキシメタゾン、デソキシコルチコステロンアセテート、デキサメタゾン、ジクロリゾン、ジフラゾンジアセテート、ジフルコルトロンバレレート、フルアドレノロン、フルクロロロンアセテート、フルドロコルチゾン、フルメタゾンピバレーート、フルオシノロンアセトニド、フルオシニド、フルコルチゾンブチルエステル、フルオコルトロン、フルプレドニデン(フルプレドニリデン)アセテート、フルランドレノロン、ハルシノニド、ヒドロコルチゾンアセテート、ヒドロコルチゾンブチレート、メチルプレドニゾロン、トリアムシノロンアセトニド、コルチゾン、コルトドキソン、フルセトニド、フルドロコルチゾン、ジフルオロゾンジアセテート、フルラドレノロンアセトニド、メドリゾン、アムシナフェル、アムシナフィド、ベタメタゾン及びそのエステル類、クロロプレドニゾン、クロルプレドニゾニアセテート、クロコルテロン、クレシノロン、ジクロリゾン、ジフルプレドネート、フルクロロニド、フルニソリド、フルオロメタロン、フルペロロン、フレプレドニゾロン、ヒドロコルチゾンバレレート、ヒドロコルチゾンシクロペンチルプロピオネート、ヒドロコルタメート、メプレドニゾン、パラメタゾン、プレドニゾロン、プレドニゾン、ベクロメタゾンジプロピオネート、トリアムシノロン及びそれらの混合物が使用されるが、これらに限定されるものではない。本発明において使用するのに好ましいステロイド系抗炎症剤はヒドロコルチゾンである。

本発明の組成物において有用である第二の抗炎症剤群としては非ステロイド系抗炎症剤が挙げられる。この群に含まれる各種化合物は当業者に周知のものである。非ステロイド系抗炎症剤の化学構造、合成、副作用等の詳細な開示内容については標準的教科書、例えば抗炎症及び抗リュマチ薬品(Anti-Inflammatory and Anti-Pheumatic Drugs)、K.D.レインズフォード(Rainsford)、Vol.I-III、CRC Rress,Boca Baton(1985)及び抗炎症剤、化学及び薬理学(Anti-inflammatory Agents,Chemistry and Pharmacology)、1、R.A.シェラー(Scherrer)等、Academic Press,New York(1974)を参照すればよい(これらの文献は茲に準用する。)

本発明の組成物に有用な具体例非ステロイド系抗炎剤としては下記のものが挙げられるが、これらに限定されるものではない：1) ピロキシカム、イソキシカム、テノキシカム、スドキシカム及びCP-14,304などのオキシカム類；

2) アスピリン、ジスアルシド、ベノリレート、トリリセート、サファプリン、ソルプリン、ジフルニザール、及びフェンドザールなどのサリチレート類；

3) シクロフェナック、フェンクロフェナック、インドメタシン、スリンダック、トルメチン、イソキセパック、フロフェナック、チオピナック、ジドメタシン、アセミタシン、フェンチアザック、ゾメピラック、クリダナック、オキセビナック、及びフェルビナックなどの酢酸誘導体；

4) メフェナミン酸、メクロフェナミン酸、フルフェナミン酸、ニフルミン酸及びトルフェナミン酸などのフェナメート類；

5) イブプロフェン、ナプロキセン、ベノキサプロフェン、フルビプロフェン、ケトプロフェン、フェノプロフェン、フェンブフェン、インドプロフェン、ピルプロフェン、カルプロフェン、オキサプロジン、プラノプロフェン、ミロプロフェン、チオキサプロフェン、スプロフェン、アルミニプロフェン及びチアプロフェンなどのプロピオン酸誘導体；及び6) フェニルブタゾン、オキシフェンブタゾン、フェプラゾン、アザプロバゾン及びトリメタゾンなどのピラゾール類。

これらの非ステロイド系抗炎剤並びにこれらの抗炎剤の薬学的に許容可能な塩及びエステルも又用いられる。例えば、エトフェナメート、フルフェナミン酸誘導体は特に局所用用途に有用である。これらの非ステロイド系抗炎剤の中でイブプロフェン、ナプロキセン、フルフェナミン酸、メフェナミン酸、メクロフェナミン酸、ピロキシカム及びフェルビナックが好ましく、イブプロフェン、ナプロキセン及びフルフェナミン酸が最も好ましい。

本発明において有用であるもう一つの抗炎剤群は米国特許出願Serial No.879,863明細書(Loomans et al.1986年6月27日出願)に開示されている抗炎剤である。この出願は特定の置換されたフェニル化合物、特に置換2,6-ジ-*t*-ブチルフェノール誘導体よりなるステロイド系抗炎剤群を開示する。例えば、4-(4'-ペニチル-3'-オン)-2,6-ジ-*t*-ブチルフェノール；4-(5'-ヘキシノイル)-2,6-ジ-*t*-ブチルフェノール；4-((S)-(-)-3'-メチル-5'-ヘキシノイル)-2,6-ジ-*t*-ブチルフェノール；4-((R)-(+)-3'-メチル-5'-ヘキシノイル)-2,6-ジ-*t*-ブチルフェノール；及び4-(3',3'-ジメトキシプロピオニル)-2,6-ジ-*t*-ブチルフェノールが本発明において有用である。

更に本発明において有用である抗炎剤群は米国特許出願Serial No.051,446明細書(Mueller,1987年5月18日出願)に開示されているものである。この出願は特定の2-ナフチル-含有エステル化合物、特に2個以上のキラル中心を有するナプロキセンエステル及びナプロキソールエステル化合物及びそのジアステレオマー混合物を開示する。例えば、(S)-ナプロキセン-(S)-2-ブチルエステル、(S)-ナプロキセン-(R)-2-ブチルエステル、(S)-ナプロキソール(R)-2-メチルブチレート、(S)-ナプロキソール(S)-2-メチルブチレート、(S)-ナプロキセン-(S)-2-ブチルエステル及び(S)-ナプロキセン-(R)-2-ブチルエステルのジアステレオマー混合物、及び(S)-ナプロキソール-(R)-2-メチルブチレートと(S)-ナプロキソール-(S)-2-メチルブチレートのジアステレオマー混合物が本発明において有用である。

最後に、所謂「天然」抗炎剤が本発明において有用である。例えばキャンデリラワックス、アルファービスアボロール、アロエベラ、マンジスタ[ルビア属(Rubia)、特にルビア・コルジフォリア(Rubia Cordifolia)の植物から抽出されたもの]、及びグッガル[コミフォラ属(Commiphora)、特にコミフォラ・ムクール(Commiphora Mukul)の植物から抽出されたもの]が用いられる。

本発明の一層より好ましい組成物はソルビン酸トコフェロール、日焼け止め剤及び光保護のための抗炎剤を含んでなるものである。その様な組成物は約1%～約10%、好ましくは約2%～約5%のソルビン酸トコフェロール、約1%～約15%、好ましくは約2%～約10%の日焼け止め、及び約0.2%～約5%、好ましくは約0.5%～約2%の抗炎剤を含んでなるものである。この組合せは各光保護剤単独により与えられるものよりも広い保護を与える。更に、この組合わせは、各活性剤単独の効果の合計により与えられるものよりも大きい光保護を与える。より大きい光保護とはUV曝露の急性効果、例えば紅斑の減少及びUV照射の慢性的効果例えば皮膚の早期のしわ形成及び垂れ下りなどの減少の両者を意味する。

本発明の組成物においては、その他のラジカル捕捉(scavenging)剤をソルビン酸トコフェロールと組合せて用いることができる。例えば、アスコルビン酸(ビタミンC)及びその塩、トコフェロール(ビタミンE)、その他のトコフェロールエステル類、ブチル化ヒドロキシ安息香酸類及びその塩、6-ヒドロキシ-2,5,7,8-テトラメチルクロマン-2-カルボン酸(商標名Trolox^Rとして市販されている)、没食子酸及びそのアルキルエステル類、特にプロピルガレート、尿酸及びその塩及びアルキルエステル類、ソルビン酸及びその塩、脂肪酸のアスコルビルエステル類、アミン類(例、N,N-ジエチルヒド

ロキシアミン、アミノグアニジン)、スルフヒドリル化合物(例、グルタチオン)及びジヒドロキシフルマル酸及びその塩などがある。これらの化合物の各々は光保護能力を有する。しかしながら、本発明におけるソルビン酸トコフェロール単独の使用が好ましい。

約1%～約5%のこれらのラジカル捕捉化合物が茲に教示される割合のソルビン酸トコフェロールと組合わせて本発明において用いられる。正確な量はこれらの化合物は幾分強度において異なるので用いられる特別の化合物に応じて異なる。

UV曝露により引起される悪影響の防止方法 本発明は更に人及び低級動物の皮膚をUV照射の悪影響から保護する方法に関する。ソルビン酸トコフェロールによるその様な保護は急性UV曝露から生ずる損傷、例えば紅斑のみならず、慢性UV照射から生ずる損傷例えば光老化にも及ぶものである。

その様な方法は人或いは低級動物の皮膚に安全且つ光保護的に有効量のソルビン酸トコフェロールを適用することによりなるものである。これは本出願において説明されたソルビン酸トコフェロールよりなる組成物を用いることにより達成される。茲に用いられる「安全且つ光保護的に有効量」という用語はUV照射の悪影響を実質的に減少するのに十分であるが、しかし、如何なる副作用或いは悪い皮膚反応を引起す程には多くない秒を意味する。典型的には、安全且つ光保護的に有効量とはcm²皮膚当り約0.01mg～約1.0mg、好ましくは約0.5mg～約0.5mgである。ソルビン酸トコフェロールは皮膚に単に広げるか或いはスプレーされ、好ましくは皮膚は浸透を高めるために皮膚中に擦り込まれる。ソルビン酸トコフェロールはUV曝露前或いは同時に適用されると、最も良好に作用する。それは又UV照射後約30分まで適用されてもよい。しかしながら、UV曝露中、皮膚上に被膜として残らなければならない典型的な日焼け止めと異なり、ソルビン酸トコフェロールの適用は曝露前4時間までになされればよい。これは活性剤が皮膚に浸透して作用するからであり、擦り落し、洗い落し、或いは摩滅には余り影響されない。UV照射からの急性損傷に対して保護するためにはソルビン酸トコフェロールの曝露直前の適用が好ましい。UV照射からの慢性的損傷に対する保護のためにはソルビン酸トコフェロールの毎日の数回の適用、通常毎日約2回及び約5回、好ましくは2回、が好ましい。

UV曝露により引起される悪影響を防止するための本発明の好ましい方法は安全且つ光保護的に有効量のソルビン酸トコフェロール及び安全且つ光保護的に有効量の日焼け止め剤の両者を皮膚に同時に適用することを含むものである。同時適用とはこれらの試剤を体の同一箇所にほぼ同時に適用することを意味する。これは、これらの試剤の一方を他方の適用後適用することによって達成することができるが、好ましくは両試剤を混ぜ合わせた組成物が皮膚に適用される。日焼け止め剤の「安全且つ光保護的に有効量」とは皮膚に対するUV照射の悪影響を実質的に減少させるのに十分であるが、しかし、如何なる副作用或いは悪い皮膚反応を引起さない量を意味し、通常皮膚のcm²当り約0.01mg～約1.0mg、好ましくは約0.05mg～約0.5mgの日焼け止め剤である。

好ましくは、本発明において用いられる日焼け止め剤は2-エチルヘキシリp-メトキシシンナメト;ブチルメトキシジベンゾイルメタン;2-ヒドロキシー-4-メトキシベンゾフェノン;オクチルジメチルp-アミノ安息香酸、2,4-ジヒドロキシベンゾイルメタンの4-N,N-(2-エチルヘキシリ)メチルアミノ安息香酸エステル;4-ヒドロキシベンゾイルメタンの4-N,N-(2-エチルヘキシリ)メチルアミノ安息香酸エステル;2-ヒドロキシー-4-(2-ヒドロキシエトキシ)ベンゾフェノンの4-N,N-(2-エチルヘキシリ)メチルアミノ安息香酸エステル;4-(2-ヒドロキシエトキシ)ジベンゾイルメタンの4-N,N-(2-エチルヘキシリ)メチルアミノ安息香酸エステル;2-ヒドロキシー-4-(2-ヒドロキシエトキシ)ベンゾフェノンのN,N-ジー(2-エチルヘキシリ)-4-アミノ安息香酸エステル;4-(2-ヒドロキシエトキシ)ジベンゾイルメタンのN,N-ジー(2-エチルヘキシリ)-4-アミノ安息香酸エステル及びそれらの混合物よりなる群から選ばれる。

ソルビン酸トコフェロール及び日焼け止め剤は単に皮膚上に広げられるか或いはソルビン酸トコフェロールの浸透を高めるために皮膚中に擦り込まれる。これらの活性剤はUV曝露に関連して即ちUV曝露前、同時或いは後に適用される。UV照射からの急性損傷に対する保護のためには曝露直前の活性剤の適用で十分である。UV照射の慢性的損傷に対する保護のためには毎日数回、例えば毎日約2回の適用が好ましい。

UV曝露の悪い急性の効果例、紅斑を抑制するための抗炎症剤の使用は公知である。しかしながら、本発明において抗炎症剤を用いてUV曝露の悪い慢性的効果例例えば皮膚の早期しわ形成、垂れ下りが抑制されることが発見された。即ち、本発明は皮膚に安全且つ光保護的に有効量の抗炎症剤の慢性的適用を行うことを特徴とするUV照射の慢性的効果から皮膚を保護する方法に関する。茲に用いられる「安全且つ光保護的に有効量」とは皮膚へのUV照射の悪影響を実質的に減少させるに十分であるが、しかし、如何なる副作用或いは悪い皮膚反応を引起さない量を意味す

る。典型的には、安全且つ光保護的に有効量はcm²皮膚当り約0.005mg～約0.5mg、好ましくは約0.01mg～約0.1mgの抗炎症剤である。「慢性的適用」とは、7日間、好ましくは10日間を越える長期間に亘って皮膚に毎日数回通常約2回～約5回、好ましくは2回適用することを意味する。好ましくは、この適用処法はユーザーが自らを損傷を引起こすUV照射に慢性的に曝露する間中継続するのがよい。これは数日間、数ヶ月或いはそれ以上に亘る適用を含むものである。抗炎症剤は単に皮膚に広げればよいが、好ましくは浸透を高めるために皮膚内に擦り込むのがよい。

好ましくは、本発明において用いられる抗炎症剤はヒドロコルチゾン、イブプロフェン、ナプロキセン、フルフェナミン酸、メフェナミン酸、メクロフェナミン酸、ピロキシカム、フェルビナック、4-(4' -ペンチル-3' -オン)-2,6-ジ-t-ブチルフェノール;4-(5' -ヘキシノイル)-2,6-ジ-t-ブチルフェノール、4-((S)-(-)-3' -メチル-5' -ヘキシノイル)-2,6-ジ-t-ブチルフェノール、4-((R)-(+)-3' -メチル-5' -ヘキシノイル)-2,6-ジ-t-ブチルフェノール、4-(3,3' -ジメトキシプロピオニル)-2,6-ジ-t-ブチルフェノール、マンジスタ、グッガル及びそれらの混合物よりなる群から選ばれる。

UV曝露により引起こされる悪い影響を防止するための本発明のより好ましい方法は安全且つ光保護的に有効量のソルビン酸トコフェロール及び安全且つ光保護的に有効量の抗炎症剤の両者を皮膚に同時に適用することを含むものである。「同時」とは、これらの試剤の体の同一箇所の皮膚への約同時の適用を意味する。これは、これらの試剤の一方を他方の適用後に皮膚に適用することによって達成することができる、好ましくは両試剤を混ぜ合わせてなる組成物を皮膚に適用するのがよい。各試剤の「安全且つ光保護的に有効量」とはUV照射の皮膚への有害な影響を実質的に減少させるのに十分であるが、しかし、如何なる副作用或いは悪い皮膚反応を引起こす程ではない量を意味し、通常cm²皮膚当り約0.005mg～約0.5mg、好ましくは約0.01mg～約0.1mgの抗炎症剤及びcm²の皮膚当り約0.01mg～約1.0mg、好ましくは約0.05mg～約0.5mgのソルビン酸トコフェロールである。ソルビン酸トコフェロール及び抗炎症剤は単に皮膚上に広げて良いが、しかし、好ましくは浸透を高めるために皮膚中に擦り込むのがよい。

ソルビン酸トコフェロール単独の場合と異なり、ソルビン酸トコフェロール+抗炎症剤の組合せはUV照射に関連して即ちUV照射前、同時或いは後に適用される。即ち、この組合せはUV曝露前約4時間前まで、UV曝露後30分後まで或いはその間の任意の時間において適用される。これは、UV曝露後適用されても抗炎症剤が作用して皮膚内の悪い反応を最少にするからである。UV照射からの急性損傷に対する保護のためには、ソルビン酸トコフェロール及び抗炎症剤の曝露直前或いは曝露直後の適用が十分である。UV照射からの慢性的損傷に対する保護のためには、ソルビン酸トコフェロールと抗炎症剤の毎日数回例えば約2回～約5回、好ましくは毎日2回の適用が好ましい。

更に、UV曝露により引起こされる悪影響を防止するための、本発明のもう一つの方法は安全且つ光保護的に有効量のソルビン酸トコフェロール、安全且つ光保護的に有効量の抗炎症剤及び安全且つ光保護的に有効量の日焼け止め剤を皮膚に同時に適用することを含むものである。「同時」とは、これらの試剤の体の同一部位の皮膚への約同時の適用を意味する。これは、これらの試剤の皮膚への逐次的(次々と)適用することにより達成することができるが、好ましくは全ての三つの試剤を混ぜ合わせてなる組成物が皮膚に適用される。各試剤の「安全且つ光保護的に有効量」とは皮膚に対するUV照射の悪影響を実質的に減少させるのに十分であるが、しかし、如何なる副作用或いは悪い皮膚反応も引起こさない程度の量を意味し、通常cm²皮膚当り、約0.01mg～約1mg、好ましくは約0.05mg～約0.5mgのソルビン酸トコフェロール、cm²皮膚当り約0.005mg～約0.5mg、好ましくは約0.01mg～約0.1mgの抗炎症剤及びcm²皮膚当り約0.01mg～約1mg、好ましくは約0.05mg～約0.5mgの日焼け止め剤である。ソルビン酸トコフェロール、抗一炎症剤、及び日焼け止め剤は単に皮膚上に広げればよいが、好ましくは浸透を高めるために皮膚中に擦り込まれる。この組合せはUV曝露に関連して、即ちUV曝露の前、同時に或いは後に適用される。即ち、この組合せはUV曝露前約4時間まで、UV曝露後約30分まで或いはその間の任意の時間に適用される。

UV照射からの急性損傷に対する保護のためには、ソルビン酸トコフェロール、抗炎症剤及び日焼け止め剤のUV曝露直前の適用で十分である。UV照射からの慢性的損傷に対する保護のためには、ソルビン酸トコフェロール、抗炎症剤及び日焼け止め剤の毎日数回の適用、例えば約2回～約5回、好ましくは毎日2回の適用が好ましい。

以下の具体例は本発明の範囲内の好ましい実施態様を更に説明し例示するものである。これらの具体例は例示を目的としてのみ与えられるものであり、その数多くの変化がその趣旨及び範囲を離れることなく可能があるので、本発明の限定するものとは考えられてはならない。

実施例中の全てのパーセント及び比率は特に断りのない限り、重量基準である。

例I 湿りを与えるローションを通常の混合技術を利用して下記の成分を組合わせることにより調製する。

成 分 組成物の重量%水(精 製) 70.94Carbomer粘度調節剤(R.I.A.Corp.からAcritamer系列で市販) 0.23アルキルパラベン類 0.90グリセリン 3.50水酸化カリウム 0.09—0.15四ナトリウムEDTA 0.10セチルアルコール 1.25ステアリン酸 0.75グリセリルステアレート 0.63ポリオキシエチレンステアリルアルコール(ICI Americas,Inc.からBrij系列で市販) 1.75ココーカプリレート/カプリレート 2.00C₁₂—C₁₅アルコールベンゾエート(Finetex,Inc.から市販のFinsolv-TN) 2.00ソルビン酸トコフェロール

2.00オクチルメトキシンナメート 7.50ベンゾフェノール-3 1.00オクチルジメチルPABA 1.00ジメチコン 0.30イミダゾリジニル尿素 0.10エチレンアクリレート共重合体 3.80チロシン 0.10このローションは急性或いは慢性UV曝露により引起される損傷を抑制するために局所的に適用される。約

0.5mg/cm²のソルビン酸トコフェロール及び約0.5mg/cm²の日焼け止め剤をUV曝露の直前に皮膚に沈積するのに十分な量のローションの使用が適当である。ローションがUV曝露前4時間まで或いはUV曝露後30分までに適用されるならば実質的に同様な結果が得られる。

オクチルメトキシンナメート、ベンゾフェノール-3、及びオクチルジメチルPABAを全部或いは部分的に2-エチルヘキシルp-メトキシンナメート、ブチルメトキシジベンゾイルメタン、2-ヒドロキシ-4-メキシベンゾフェノン及びそれらの混合物で置換する場合にも実質的に同様な結果が得られる。

例II 皮膚ローションを通常の混合技術を利用して下記成分を組合わせることにより調製する。

成 分 組成物の重量%4-(2-ヒドロキシエトキシ)

ジベンゾイルメタンの4,N,N-(2-エチルヘキシル)メチルアミノ安息香酸エステル 10.00水(精 製) 47.54ジメチルレイソルバイト 8.00ジオクチルマレエート 8.00C₁₂—C₁₅アルコールベンゾエート

(Finetex,Inc.から市販のFinsolv-TN) 8.00グリセリン 3.50エチレンアクリレート共重合体 3.80ソルビン酸トコフェロール 2.00セチルアルコール 1.75ポリオキシエチレンステアリルアルコール(ICI Americas,Inc.からBrij系列で市販) 1.75ステアリン酸 1.25グリセリルステアレート 1.13アルキルパラベン類 0.90二酸化チタン 0.40ジメチコン 0.30カルボマー粘度調節剤(R.I.T.A.Corp.からAcritamer系列で市販) 0.23イミダゾリジニル尿素 0.10水酸化カリウム 0.15チロシン 0.10四ナトリウムEDTA 0.10このローションは急性或いはUV曝露により引起される損傷を抑制するための局所適用に有用である。約0.5mg/cm²のソルビン酸トコフェロール及び約0.5mg/cm²の日焼け止め剤をUV曝露の直前に沈積するのに十分な量のローションの使用が適用である。ローションがUV曝露前4時間まで或いはUV曝露後30分までに適用されるならば実質的に同様な結果が得られる。

4-(2-ヒドロキシエトキシ)ジベンゾイルメタンの4-N,N-(2-エチルヘキシル)メチルアミノ安息香酸エステルが全部或いは部分的に2,4-ジヒドロキシベンゾフェノンの4-N,N-(2-エチルヘキシル)メチルアミノ安息香酸エステル、4-ヒドロキシジベンゾイルメタンのN,N-ジ-(2-エチルヘキシル)-4-アミノ安息香酸エステル、2-ヒドロキシ-4-(2-ヒドロキシエトキシ)ベンゾフェノンの4-N,N-(2-エチルヘキシル)メチルアミノ安息香酸エステル、4-(2-ヒドロキシエトキシ)ジベンゾイルメタンの4-N,N-(2-エチルヘキシル)メチルアミノ安息香酸エステル、2-ヒドロキシ-4-(2-ヒドロキシエトキシ)ベンゾフェノンのN,N-ジ-(2-エチルヘキシル)-4-アミノ安息香酸エステル、或いは4-(2-ヒドロキシエトキシ)ジベンゾイルエタンのN,N-ジ-(2-エチルヘキシル)-4-アミノ安息香酸エステル、及びそれらの混合物で置換される場合にも実質的に同様な結果が得られる。

例III 日焼けクリームの通常の混合技術を利用して下記成分を組合わせて調製する。

成 分 組成物の重量%鉱物油 20.00オクチルパルミテート 10.00グリセリルイソステアレート 4.00オクチルメトキシンナメート 7.50オキシベンゾン 3.00ポリエチレン(AC-617-A, AC-6-A, Allied Chemicalから市販) 2.00アルキルパラベン類 0.30グリセリン 2.00ソルビン酸トコフェロール 2.00イブプロフェン 1.00水(精 製) 適 量 このローションは急性或いはUV曝露により引起される損傷を抑制するための局所適用に有用である。約0.5mg/cm²のソルビン酸トコフェロール及び約0.5mg/cm²の日焼け止め剤、及び約0.1mg/cm²のイブプロフェンをUV曝露の直前に沈積するのに十分な量のローションの使用が適当である。ローションがUV曝露前4時間まで或いはUV曝露後30分までに適用されるならば実質的に同様な効果が得られる。

オクチルメトキシンナメート及びオキシベンゾンが全部或いは部分的に2-エチルヘキシルp-メトキシンナメート、ブチルメトキシジベンゾイルメタン、2-ヒドロキシ-4-メキシベンゾフェノン及びそれらの混合物で置換される場合にも実質的に同様な結果が得られる。

イブプロフェンが全部或いは部分的にヒドロコルチゾンアセテート、ナプロキセン、フルフェナミン酸、

メフェナミン酸、メクロフェナミン酸、ピロキシカム、フェルビナック、4-(4' -ペニチル-3' -オノン)-2,6-ジ-*t*-ブチルフェノール、4-(5' -ヘキシノイル)-2,6-ジ-*t*-ブチルフェノール、4-(S)-(-)-3' -メチル-5' -ヘキシノイル-2,6-ジ-*t*-ブチルフェノール、4-(R)-(+)-3' -メチル-5' -ヘキシノイル-2,6-ジ-*t*-ブチルフェノール、4-(3',3' -ジメトキシプロピオニル)-2,6-ジ-*t*-ブチルフェノール、マンジスタ(Manjistha)、グッガル(Guggal)及びそれらの混合物で置換される場合にも実質的に同様な結果が得られる。

例IV 日焼けスティックを通常の混合技術を利用して下記成分を組合わせることにより調製する。

成 分 組成物の重量% キャンデリラワックス 19.25 オゾケライトワックス 19.25 ワセリン 19.25 ラノリン 15.00 鉛物油 14.85 オクチルジメチルPABA 7.00 ベンゾフェノン-3 3.00 BHA(防腐剤:ブチル化ヒドロキシアニソール) 0.05 プロピルパラベン 0.10 ソルビン酸トコフェロール 5.00 香料 適量 このスティックは急性或いは慢性UV曝露により引起される炎症を抑制するために例えば口唇に局所適用するのに適したものである。約0.5mg/cm²のソルビン酸トコフェロール及び約0.5mg/cm²の日焼け止め剤の口唇へのUV曝露直前に沈積するのに十分な量のスティックの使用が適当である。スティックをUV曝露前4時間まで或いはUV曝露後30分までに適用されるならば実質的に同様な結果が得られる。

オクチルジメチルPABA及びベンゾフェノン-3が全部或いは部分的に、2-エチルヘキシルp-メトキシシンナメート、ブチルメトキシジベンゾイルメタン、2-ヒドロキシ-4-メトキシベンゾフェノン及びそれらの混合物で置換されても実質的に同様な結果が得られる。

例V 低SPF日焼けクリームを通常の混合技術を利用して下記成分を組合わせることにより調製する。

成 分 組成物の重量% 四ナトリウムEDTA 0.05 アルキルパラベン類 0.30 Carbopol(ポリアクリル酸重合体-B.F.Goodrich Chemicalから市販) 0.20 グリセリン 2.00 Laureth-23(ラウリルアルコールのポリエチレングリコールエーテル) 3.00 ソルビタンステアレート 1.50 オクチルジメチルPABA 3.00 ジメチコン 2.00 ステアリルアルコール 6.00 トリエタノールアミン 0.20 ソルビン酸トコフェロール 2.00 水(精製) 適量 このクリームは急性或いは慢性UV曝露により引起される損傷を抑制するための局所適用に有用である。約0.5mg/cm²のソルビン酸トコフェロール及び約0.5mg/cm²の日焼け止め剤を皮膚へのUV曝露直前に沈積するのに十分な量のクリームの使用が適当である。クリームがUV曝露前4時間まで或いはUV曝露後30分までに皮膚に適用されるならば実質的に同様な結果が得られる。オクチルジメチルPABAが全部或いは部分的に、2-エチルヘキシルp-メトキシシンナメート、ブチルメトキシジベンゾイルメタン、2-ヒドロキシ-4-メトキシベンゾフェノン及びそれらの混合物で置換されても実質的に同様な結果が得られる。

例VI 日焼け水性美顔用ゲルを通常の混合技術を利用して下記成分を組合わせることにより調製する。

成 分 組成物の重量% 水(精製) 50.00 アロエ 38.00 Carbopol 1.00 グリセリン 3.00 メチルパラベン 0.20 トリエタノールアミン 0.902-フェニル-ベンジメドイクスルホン酸 2.00 オクトキシノール-13(エトキシル化アルキルフェノール(C₈H₁₇)(C₆H₄)(COH₂CH₂)_nOH, n=平均値13) 1.50 ソルビン酸トコフェロール 2.00 着色剤及び香料 適量 この水性ゲルは急性或いは慢性UV曝露により引起される損傷を抑制するために顔に適用されるのに有用である。約0.5mg/cm²のソルビン酸トコフェロールをUV曝露直前に顔へ沈積するのに十分な量のゲルの使用が適用である。ゲルが顔にUV曝露4時間前まで或いはUV曝露30分後までに適用されるならば実質的に同様な結果が得られる。

例VII 日焼けゲルを通常の混合技術を利用して下記成分を組合わせることにより調製する。

成 分 組成物の重量% オゾケライトワックス 10.00 パラフィン 10.00 ワセリン 10.00 イソプロピルミリステート 5.00 鉛油 58.00 オクチルジメチルPABA 2.50 プロピルパラベン 0.10 BHA 0.05 ソルビン酸トコフェロール 2.00 ナプロキセン 2.00 香料及び着色料 適量 この日焼けゲルは急性或いは慢性UV曝露により引起される損傷を抑制するために局所適用されるのが有用である。約0.5mg/cm²のソルビン酸トコフェロール、約0.5mg/cm²の日焼け止め剤、及び約0.1mg/cm²のナプロキセンをUV曝露直前に皮膚へ沈積するのに十分な量のゲルの使用が適当である。ゲルが皮膚にUV曝露30分後まで或いはUV曝露4時間前までに適用されるならば実質的に同様な結果が得られる。

オクチルジメチルPABAが全部或いは部分的に2-エチルヘキシルp-メトキシシンナメート、ブチルメトキシジベンゾイルメタン、2-ヒドロキシ-4-メトキシベンゾフェノン及びそれらの混合物で置換されても実質的に同様な結果が得られる。

ナプロキセンが全部或いは部分的にハイドロコルチゾンアセテート、イソプロフェン、フルフェナミン酸、メフェナミン酸、メクロフェナミン酸、ピロキシカム、フェルビナック、4-(4' -ペニチル-3' -オノン)-2,6-ジ-*t*-ブチルフェノール、4-(5' -ヘキシノイル)-2,6-ジ-*t*-ブチルフェノール、

4-(S)-(-)-3'-メチル-5'-ヘキシノイル-2,6-ジ-*t*-ブチルフェノール、4-(R)-(+)-3'-メチル-5'-ヘキシノイル-2,6-ジ-*t*-ブチルフェノール、4-(3',3'-ジメトキシプロピオニル)-2,6-ジ-*t*-ブチルフェノール、マンジスタ、グッガル及びそれらの混合物で置換される場合にも実質的に同様の結果が得られる。

例VIII 日焼け油を通常の混合技術を利用して下記成分を組合わせることにより調製する。

成 分 組成物の重量%ゴマ油 5.0 シクロメチコン 20.0 イソプロピルミリストート 5.0 BHA 0.05 ソルビタンオレエート 1.0 オクチルジメチルPABA 1.5 プロピルパラベン 0.7 ソルビン酸トコフェロール 2.00 鉛油 適量 この日焼け油は急性或いは慢性UV曝露により引起される損傷を抑制するために局部適用されるのが有用である。0.5mg/cm²のソルビン酸トコフェロール、約0.5mg/cm²の日焼け止め剤をUV曝露直前皮膚へ沈積するのに十分な量の油の使用が適当である。油が皮膚にUV曝露4時間前までに或いはUV曝露後30分までに適用されるならば実質的に同様な結果が得られる。

オクチルジメチルPABAが全部或いは部分的に2-エチルヘキシルp-メキシシンナメート、ブチルメキシジベンゾイルメタン、2-ヒドロキシ-4-メキシベンゾフェノン及びそれらの混合物で置換されても実質的に同様な結果が得られる。

例IX 湿りを与えるシリコーン中水中油日焼け止めエマルジョンローションを下記成分から形成する。

成 分 組成物の重量%水 相: 精製水 57.17 パネチン、80%水溶液(調湿剤) 0.10 メチルパラベン 0.20 Carbomer 粘度調節剤(R.I.A.Corp.からAcrithamer系列で市販) 0.10 グリセリン 2.50 ナトリウムアルキルポリエーテルスルホネート(アニオン性乳化剤) 0.10 油 相: 重質鉛物油 1.75 コレスステロール 1.00 セチルパルミテート 0.20 PEG-22/ドデシルグリコール共重合体 0.20 エチルパラベン 0.10 プロピルパラベン 0.15 中和剤ベース: トリエタノールアミン 0.10 着色剤及び香料: FD & C Red No.4(1%水溶液) 0.03 着臭剤油 0.03 シリコーン相: シクロメチコン/ジメチコンコポリオール(90:10) 9.50 シクロメチコン/ジメチコノール(13:87) 5.00 シクロメチコン 3.00 フェニルジメチコン 1.00 Pareth-15-3(混合合成C₁₁-C₁₅脂肪アルコールのポリエチレンジリコールエステル、平均=3モルEO) 2.00 オクチルメキシシンナメート 7.00 ベンゾフェノン-3 0.50 ナプロキセン 2.00 ソルビン酸トコフェロール 2.00 C₁₂₋₁₅ アルコールベンゾエート 2.85 適当な機械的攪拌機(Tekmar Model RW-20攪拌モーター、IKA-WERK、西ドイツ製)を備えた適当な大きさの容器内において、水、パンテチン、メチルパラベン、グリセリン及びスルホネート乳化剤を約72~75°Cまで加熱し、混合する。攪拌は水溶液中に渦巻きが形成されるまで増大される。増粘剤、Carbomerをゆっくり渦巻きに添加し、完全に水和し、得られたゲル溶液がゼラチン状粒子がなくなり組成が均一になるまで混合させる。温度は一定の攪拌により約72~75°Cに維持する。

油相の成分を別の適当な大きさの容器を添加し、油相が一度溶融した時点で遅い機械的攪拌を用いて約80~85°Cまで加熱する。この時点で、日焼け止め剤、ナプロキセン及びソルビン酸トコフェロールを混入する。溶融した時点で攪拌を維持して油相を加熱時に均一に保持する。

加熱された油相を次いで攪拌しながらゆっくり加熱した水相に添加し、水中油エマルジョンを形成する。添加完了後、エマルジョンの不必要な空気混和を避けるために機械的攪拌手段を減速し、混合を70~75°Cにおいて約15分間継続する。エマルジョンを次いで適度の攪拌をもって約60°Cまで冷却する。塩基、トリエタノールアミンを次いでゆっくり添加して酸性Carbomer940を中和し、エマルジョン(pH6.5)を適当な速度で均一になるまで混合する。この均質な水中油エマルジョンを次いで約45~50°Cまで冷却し、着色剤及び着臭剤油を添加後適度な攪拌を継続して室温(約25°C)まで冷却する。

四つのシリコーン流体及びその他のシリコーン相成分を均質なシリコーン相が達成されるまで別の容器内で一緒に混合する。水中油エマルジョンをシリコーン相に攪拌しながらローション形態の均質なシリコーン中水中油二重重エマルジョンが達成されるまでゆっくり添加する。

この湿りを与えるローションは急性或いは慢性UV曝露により引起される損傷を抑制するために局部適用に有用である。約0.5mg/cm²のソルビン酸トコフェロール、約0.5mg/cm²の日焼け止め剤及び約0.1mg/cm²のナプロキセンをUV曝露直前皮膚へ沈積するのに十分な量のローションの使用が適当である。ローションが皮膚にUV曝露後30分まで及びUV曝露前4時間までに適用されると実質的に同様な結果が得られる。このローションは又、慢性UV曝露により引起される損傷を抑制するために約0.5mg/cm²のソルビン酸トコフェロール、約0.5mg/cm²の日焼け止め剤及び約0.1mg/cm²のナプロキセンを皮膚に沈積させるのに十分な量で毎日数回、例えば毎日2或いは3回、長期間に亘って、例えば1週間より長く適用されてもよい。

オクチルメキシシンナメート及びベンゾフェノン-3が全部或いは部分的に、2-エチルヘキシルp-メキシシンナメート、ブチルメキシベンゾイルメタン、2-ヒドロキシ-4-メキシベンゾフェノン、及びそれらの混合物で置換されても実質的に同様な結果が得られる。

ナプロキセンが全部或いは部分的にヒドロコルチゾンアセテート、イブプロフェン、フルフェナミン酸、メフェナミン酸、メクロフェナミン酸、ピロキシカム、フェルビナック、4-(4' -ペニンチル-3' -オニ) -2,6-ジ-*t*-ブチルフェノール、4-(5' -ヘキシノイル)-2,6-ジ-*t*-ブチルフェノール、4-(S)-(-)-3' -メチル-5' -ヘキシノイル-2,6-ジ-*t*-ブチルフェノール、4-(R)-(+)-3' -メチル-5' -ヘキシノイル-2,6-ジ-*t*-ブチルフェノール、4-(3',3' -ジメトキシブロピオニル)-2,6-ジ-*t*-ブチルフェノール、マンジスタ、グッガル、及びそれらの混合物で置換されても実質的に同様の結果が得れる。

例X 下記成分から皮膚コンディショニングトイレット棒を調製する。

成分 組成物の重量% 獣油／ヤシ油石けん(50/50) 61.61水 10.002-ヒドロキシプロピルグリセリルエーテル 4.00ナトリウムヤシグリセリルエーテルスルホネート 8.80ヤシ脂肪酸(CnFA) 4.00ソルビン酸トコフェロール 5.00香料 1.40NaCl 1.04Na₂SO₄ 0.34Na₄EDTA 0.06TiO₂ 0.20Jaguar C15(クアーヒドロキシプロピルトリモニウムクロライド) 1.00Merquat 550(ポリカタニウム-7) 1.00少量成分(着色剤、防腐剤、充填剤など) 1.55 上記組成物は次の様にして調製される。

クラッチャーミックス工程 29.8%の水、52.7%の50/50牛脂／ヤシ(T/Cn)石けん、16.7%のナトリウムヤシグリセリルエーテルスルホネートペースト、3.3%ヤシ遊離脂肪酸(CnFA)、3.1%の2-ヒドロキシプロピルグリセリルエーテル、及び0.2%のNaClを含有するミックスの約127.6部を約150～200°F(65～94°C)に加熱する。約10.0部の水和重合体JAGUAR C-15を混入する。次いでソルビン酸トコフェロールを添加し、混入する。

真空乾燥工程 クラッチャーミックスをミックスの水分を約10%に減少させ、この石けんをヌードルにするために約50mmHg絶対圧力で真空乾燥させる。これらのヌードルを一度ロール掛け工程を通過させる。

混汞工程 一度ロール掛けした石けんヌードルを秤量し、バッチ混汞機内に入れる。混汞機内の約99.1部のヌードルに0.20部のTiO₂、1.4部の香料、0.15部の着色剤溶液、0.15部の約40%のEDTAを含有する溶液を添加した。これらの合一した成分を十分に混合する。

ロール掛け工程 3本ロールの石けんミルを全てのロールを85～105°F(29～41°C)に設定した。混汞機からの混合物をミルを数回通過させて均質なミックスを得た。これは緊密混合工程である。

成形及び打抜き工程 通常の成形機を約90°F(32°C)のバレル温度及び約110°F(43°C)の先端温度に設定する。用いる成形機は二段の間に約40～65mmHgの真空を可能にする二段二軸成形機である。成形機から押出される石けん棒は典型的には円形或いは楕円形であり個々のプラグに切断される。これらのプラグを次いで通常の石けん打抜き装置上で打抜いて最終トイレット石けん棒を得る。

このトイレット棒の清浄化への使用は急性或いは慢性UV曝露により引起される損傷を抑制するためのソルビン酸トコフェロールの皮膚への沈積のための有用な手段を提供する。約0.05mg/cm²のソルビン酸トコフェロールがUV曝露直前に皮膚に沈積されるようなトイレット棒の使用が適当である。トイレット棒がUV曝露4時間前まで或いはUV曝露30分後までに使用されると実質的に同様な結果が得られる。

例XI化粧清浄化剤 化粧清浄化剤(泡立てムース組成物)を下記成分から調製する。

エマルジョン濃縮液(A) 組成物の重量% DRO水¹ 52.632-ヒドロキシプロピルグリセリルエーテル 15.00ナトリウムグリセリルエーテルスルホネート(90%ヤシ/10獣脂)-50%活性 12.06ナトリウムラウロイルサルコシネート-33%活性 6.66PEG600 4.00アロエベラゲル 1.00Lexein LP170P(加水分解動物蛋白質) 1.00ステアリン酸 1.00クエン酸 0.30ソルビン酸トコフェロール 5.00Jaguar C14-S(クアーヒドロキシプロピルトリモニウムクロライド) 0.25香料 0.20FD & CRed染料#4 0.20ラウリルアルコール 0.20アルキルパラベン類 0.30Germall 115(イミダゾリジニル尿素) 0.10Na₄EDTA 0.10¹二重逆浸透により精製した水A-46噴射剤(イソブタン-プロパン)(B)(100g濃縮液中6.4g)

この組成物は単一バッチ法により調製する。

DRO水を71.1°Cにし、Jaguar重合体を攪拌しながら添加する。攪拌を維持しながら、次の成分を逐次添加する:ナトリウムグリセロールエーテルスルホネート、ナトリウムラウロイルサルコシネート、ラウリルアルコール、PEG-600、パラベン類、EDTA、染料、2-ヒドロキシプロピルグリセリルエーテル、ステアリン酸、アロエベラゲル、クエン酸及びソルビン酸トコフェロール。この混合物を次いで135～140°Fまで冷却し、次の成分を逐次攪拌しながら添加したLexein,Cermall及び香料。得られた混合物を室温まで冷却する。

アルミニウム缶に次いで冷却したエマルジョン濃縮液を充填する。エアロゾール作動機組立物を次

いで缶に締め付けて緊密なシールを形成する。加圧A-46噴射剤を次いで各缶に6%の噴射剤及び94%エマルジョン濃縮液よりなる組成物を与える十分な量を缶中にポンプで入れる。エアロゾール組立物の作動時に組成物はクリーム状の泡立つムースの形態で加圧下に分配され、それは皮膚に清浄化のため及び急性或いは慢性UV曝露により引起される損傷を抑制するためソルビン酸トコフェロールを皮膚に沈積する手段として適用することができる。約0.05mg/cm²のソルビン酸トコフェロールをUV曝露直前に皮膚に沈積するのに十分な化粧清浄化剤の適用が適当である。清浄化剤がUV曝露4時間前まで或いはUV曝露30分後までに使用されると実質的に同様な結果が得られる。

例XII 下記成分を以下に説明するように組合わせることによりクリーム石けんを調製する。

成 分 組成物の重量%ナトリウムラウロイルグルタメート(Acylglutamate LS-11)(28) 22.00ナトリウム水素化鰐脂グルタメート及びココイルグルタメート(Acylglutamate GS-11)(28) 3.00ポリエチレングリコール400 10.00ポリエチレングリコール(M.W.6300)モノステアレート 5.00ポリオキシエチレン(20)

ソルビタンモノステアレート 3.00ソルビン酸トコフェロール 5.00フルフェナミン酸 5.002-エチルヘキシルメキシシンナメート 3.00水 33.50グリセリン 10.00香料及び防腐剤 適量(q.s.)グルタミン酸ナトリウム、ナトリウム水素添加鰐脂グルタメート及びココイルグルタメート、ポリエチレングリコール、ポリエチレングリコールモノステアレート、ポリオキシエチレンソルビタンモノステアレート、ソルビン酸トコフェロール、フルフェナミン酸、2-エチルヘキシルメキシシンナメート及び水を加熱しながら一緒に溶解する。グリセリンを攪拌しながら添加する。混合物を約60°Cまで冷却し、香料及び防腐剤を添加する。混合物を攪拌しながら35°Cまで冷却する。

結果はその清浄化への使用が急性或いは慢性UV曝露により引起される損傷を抑制するためにソルビン酸トコフェロール、フルフェナミン酸、及び2-エチルヘキシルメキシシンナメートを皮膚に沈積するための有用な手段を与えるクリーム石けんである。約0.05mg/cm²のソルビン酸トコフェロール、0.05mg/cm²の日焼け止め剤及び0.01mg/cm²のフルフェナミン酸をUV曝露直前に皮膚に沈積するのに十分なクリーム石けんの量の使用が適当である。石けんがUV曝露30分後まで或いはUV曝露4時間前までに使用されると、実質的に同様な結果が得られる。

2-エチルヘキシルメキシシンナメートが、全部或いは部分的に、オクチルメキシシンナメート、ブチルメキシジベンゾイルメタン、2-ヒドロキシ-4-メキシベンゾフェノン及びそれらの混合物で置換されても、実質的に同様の結果が得られる。

フルフェナミン酸が、全部或いは部分的にヒドロコルチゾンアセテート、イブプロフェン、ナプロキセン、メフェナミン酸、メクロフェナミン酸、ピロキシカム、フェルビナック、4-(4'-ペニチル-3'-オン)-2,6-ジ-*t*-ブチルフェノール、4-(5'-ヘキシノイル)-2,6-ジ-*t*-ブチルフェノール、4-(S)-(-)-3'-メチル-5'-ヘキシノール-2,6-ジ-*t*-ブチルフェノール、4-(R)-(+)-3'-メチル-5'-ヘキシノイル-2,6-ジ-*t*-ブチルフェノール、4-(3',3'-ジメキシプロピオニル-2,6-ジ-*t*-ブチルフェノール、マンジスタ、グッガル、及びそれらの混合物で置換されても実質的に同様な結果が得られる。

例XIII 下記成分を組合わせることによりシャンプー組成物を作成する。

成 分 組成物の重量%アンモニウムラウリルサルフェート 12.0アンモニウムキシレンスルホネート 2.2アンモニウムラウレスサルフェート 4.0NaCl 0.5ソルビン酸トコフェロール 5.0オクチルジメチルPABA 7.0水 68.1香料及び秤量成分 1.2 アンモニウムラウリルサルフェート、アンモニウムラウレスサルフェート、及びアンモニウムキシレンスルホネートを先ず一緒に混合する。ソルビン酸トコフェロール及びオクチルジメチルPABA及び香料及び少量成分を添加し得られた混合物を70lに設定したTeckmar^Rミル内で70°Cで2分間攪拌する。

得られたシャンプー組成物を水で濡らした髪に添加し、髪を処理し、次いで濯ぎ出す。これは急性或いは慢性UV曝露により引起される損傷を抑制するために頭皮へのソルビン酸トコフェロール及びオクチルジメチルPABAの沈積を可能にする。約0.5mg/cm²のソルビン酸トコフェロール及び0.05mg/cm²の日焼け止め剤をUV曝露直前頭皮へ沈積するのに十分なシャンプーの量で使用するのが適当である。シャンプーがUV曝露30分まで或いは4時間前までに使用されても実質的に同様な結果が得られる。

オクチルジメチルPABAが全部或いは部分的に、2-エトキシヘキシルメキシシンナメート、ブチルメキシジベンゾイルメタン、2-ヒドロキシ-4-メキシベンゾフェノン、オクチルメキシシンナメート、及びそれらの混合物で置換されても実質的に同様な結果が得られる。

フルフェナミン酸が全部或いは部分的にヒドロコルチゾンアセテート、イブプロフェン、ナプロキセン、メフェナミン酸、メクロフェナミン酸、ピロキシカム、フェルビナック、4-(4'-ペニチル-3'-オ

ン) -2,6-ジ-*t*-ブチルフェノール、4-(5' -ヘキシノイル)-2,6-ジ-*t*-ブチルフェノール、4-(S)-(-)-3' -メチル-5' -ヘキシノイル-2,6-ジ-*t*-ブチルフェノール、4-(R)-(+)-3' -メチル-5' -ヘキシノイル-2,6-ジ-*t*-ブチルフェノール、4-(3',3' -ジメトキシプロピオニル)-2,6-ジ-*t*-ブチルフェノール、マンジスタ、グッガル、及びそれらの混合物で置換されても実質的に同様の結果が得られる。